

**HETEROCYCLE-CONDENSED PYRIMIDINONE DERIVATIVE AND HERBICIDE CONTAINING THE SAME**

**Publication number:** JP2000247975

**Publication date:** 2000-09-12

**Inventor:** KUDO YOSHIHIRO; IKEDA EITATSU; SATO JUN;  
MAEDA KANESHIGE; WATANABE SHIGEOMI;  
NAKAHIRA KUNIMITSU; OKI TORU; HAMADA  
NOBUYUKI

**Applicant:** NISSAN CHEMICAL IND LTD

**Classification:**

**- International:** C07D487/04; A01N43/90; C07D498/04; C07D513/04;  
C07D519/00; C07D487/00; A01N43/90; C07D498/00;  
C07D513/00; C07D519/00; (IPC1-7): C07D487/04;  
A01N43/90; C07D487/04; C07D498/04; C07D513/04;  
C07D519/00

**- European:**

**Application number:** JP19990047901 19990225

**Priority number(s):** JP19990047901 19990225

[Report a data error here](#)

**Abstract of JP2000247975**

**PROBLEM TO BE SOLVED:** To obtain a new compound having high safety to important crops including rice and soybean, having high herbicidal activity against weeds including *Scirpus juncoides* and *Monochoria vaginalis*, therefore useful as a herbicide. **SOLUTION:** This new compound is a compound of formula I (Rf is a 1-4C haloalkyl; X and Y are each C, N or the like; X-Y is N=N or the like; A is N or CH; Z is O, S or the like; Rg is H, cyano or the like; R1 and R5 are each H or a halogen; R2 is nitro or the like; R3 is a 3-8C alkenyloxycarbonyl 1-4C alkyl or the like; R4 is H, OH or the like), e.g. 8-[2,7-difluoro-3,4-dihydro-3-oxo-4-(2-propynyl)-2H-1,4-benzoxazin-6-yl]-7,8-dihydro-5-trifluoromethylimidazo[1,2-a]pyrimidin-7-one. The compound of formula I is obtained, for example, by reaction between a compound of formula II (R' is a 1-4C alkyl) and a compound of formula III and the like to form a compound of formula IV (Me is CH3) which is then reacted with sodium azide.

Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide

(19)日本国特許庁 (J P)

(12) 公 開 特 許 公 報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開2000-247975

(P2000-247975A)

(43)公開日 平成12年9月12日(2000.9.12)

(51)IntCl. <sup>7</sup>	識別記号	F I	テームコード*(参考)	
C 0 7 D 487/04	1 4 0	C 0 7 D 487/04	1 4 0	4 C 0 6 0
	1 4 2		1 4 2	4 C 0 7 2
	1 4 4		1 4 4	4 H 0 1 1
	1 4 6		1 4 6	
	1 4 7		1 4 7	
審査請求 未請求 請求項の数2 O L (全 35 頁) 最終頁に続く				

(21)出願番号 特願平11-47901

(22)出願日 平成11年2月25日(1999.2.25)

(71)出願人 000003986

日産化学工業株式会社

東京都千代田区神田錦町3丁目7番地1

(72)発明者 工藤 佳宏

千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社中央研究所内

(72)発明者 池田 栄達

千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社中央研究所内

(72)発明者 佐藤 純

千葉県船橋市坪井町722番地1 日産化学工業株式会社中央研究所内

最終頁に続く

(54)【発明の名称】 ヘテロ環縮合ピリミジノン誘導体及びそれらを含む除草剤

(57)【要約】

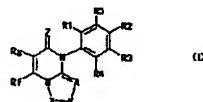
【課題】

新規除草剤の検討。

【解決手段】

式(1)：

【化1】

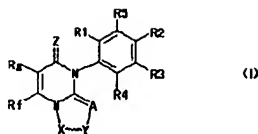


〔式中、R fはC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルキル基を表わし、X~YはN=N、CH=CH等を表わし、Aは窒素原子またはCHを表わし、Zは酸素原子または硫黄原子を表し、R gは水素原子、ハロゲン原子等を表わし、R 1は水素原子またはハロゲン原子を表わし、R 5は水素原子またはハロゲン原子を表わし、R 2は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基等を表わし、R 3は-O-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルケニル基等を表わし、R 4は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基等を表わす。〕で示される化合物およびそれらの塩。

## 【特許請求の範囲】

【請求項1】 式(1)：

【化1】



〔式中、RfはC<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>ハロアルキル基を表わし、XおよびYはそれぞれ独立して炭素原子、窒素原子、酸素原子または硫黄原子を表わし、

X~YはN=N、C(Ra)=C(Rb) (Ra、Rbはそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>ハロアルキル基、水酸基、アミノ基、メルカプト基、カルボキシル基、ヒドロキシメチル基、カルバモイル基、ホルミル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキルカルボニル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキルアミノ基、C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキルメルカプト基、C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub>アルケニルアミノ基、C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub>アルキニルアミノ基、ベンジルオキシ基、ベンジルアミノ基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキルスルホニル基、ピリジル基または置換されていてもよいフェニル(SP1)基(置換されていてもよいフェニル(SP1)基とは、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>ハロアルキル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>ハロアルコキシ基またはフェニル基によって置換されていてもよいフェニル基を表わす。)を表わす。)、C(Ra)=N(Raは前記と同様の意味を表わす。)、N=C(Ra) (Raは前記と同様の意味を表わす。)、CH(Ra)CH(Rb) (RaおよびRbは前記と同様の意味を表わす。)、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>、CH=CHCH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH=CH、NHC(Ra)Rb (RaおよびRbは前記と同様の意味を表わす。)、C(Ra)(Rb)NH (RaおよびRbは前記と同様の意味を表わす。)、C(=O)C(=O)、CH<sub>2</sub>C(=O)NH、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>、C(=O)CH(Ra) (Raは前記と同様の意味を表わす。)、CH(Ra)C(=O) (Raは前記と同様の意味を表わす。)、C(=O)NH、C(=S)NH、NHC(=O)、NHC(=S)、C(=O)C(Ra)=N(Raは前記と同様の意味を表わす。)、C(=O)C(Ra)=C(Rb) (RaおよびRbは前記と同様の意味を表わす。)、C(Ra)=C(Rb)C(=O) (RaおよびRbは前記と同様の意味を表わす。)、N=C(Ra)C(=O) (Raは前記と同様の意味を表わす。)、CH(Ra)C(=O)NH (Raは前記と同様の意味を表わす。)、C(=O)N(Ra)C(=O) (Raは前記と同様の意味を表わす。)、C(Ra)=NC(=O) (Raは前

記と同様の意味を表わす。)、C(Ra)O (Raは前記と同様の意味を表わす。)、C(=O)O、OC(=O)またはSC(=O)を表わし、

Aは窒素原子またはCHを表わし、

Zは酸素原子、硫黄原子、NRc (Rcは水素原子、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルコキシカルボニルメチル基または置換されていてもよいフェニル(SP2)基(置換されていてもよいフェニル(SP2)基とは、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルコキシ基またはC<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>ハロアルキル基によって置換されていてもよいフェニル基を表わす)またはNNHRc (Rcは前記と同様の意味を表わす。)を表わし、

Rgは水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub>アルキニル基またはC<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキル基を表わし、

R1は水素原子またはハロゲン原子を表わし、

R5は水素原子またはハロゲン原子を表わし、

R2は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、チオカルバモイル基、カルバモイル基、メルカプト基、ヒドロキシ基、アミノ基、ホルミル基、カルボキシル基、ビニル基、エチニル基、トリメチルシリルエチニル基、シアノメチル基、スルファモイル基、フェニル基、ベンジル基、C<sub>1</sub>–C<sub>8</sub>アルキル基、C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub>アルケニル基、C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>ハロアルキル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>ハロアルコキシ基、C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub>ハロアルケニル基、C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub>ハロアルキニル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アシル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキルスルホニル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub>–C<sub>2</sub>)アルキル基、–CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキル)基、–CON(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキル)<sub>2</sub>基、–CONH(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキル)基、–NH–(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキル)基、–N(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキル)<sub>2</sub>基、–S–CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキル)基、–O–Q–CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキル)基(但し、Qは飽和あるいは不飽和の分岐していてもよく、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル基、シアノ基、フェニル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>ハロアルキル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>)アルコキシ基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アシル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>)アルキル基あるいは酸素原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub>–C<sub>8</sub>のアルキレン鎖を表わす。)、フェニルエチル基、–Q–CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキル)基(但し、Qは前記と同様の意味を表わす。))または–NH–Q–CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキル)基(但し、Qは前記と同様の意味を表わす。))を表わし、

R3は、–O–R11 (R11はC<sub>3</sub>–C<sub>8</sub>シクロアルケニル基、C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub>シクロアルケニル(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>)アルキル基、シアノ(C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub>)アルキル基、シアノ(フェ

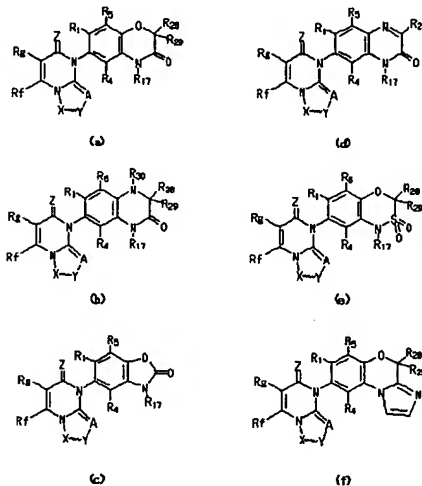
ニル)メチル基、インダニル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ)<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルコキシ(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)ハロアルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルコキシ(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニルオキシ(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルオキシ(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルチオ(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基、ケト(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)シクロアルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アシル(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルスルホニル(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル)<sub>2</sub>メチル基、ビリジル(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基、5-トリフルオロメチル-3-クロロ-2-ビリジル基、(置換されていてもよいフェニル(SP3)基)カルボニル基、(置換されていてもよいフェニル(SP1)基)とは、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルコキシ基、メタンスルホニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル基、ニトロ基、ヒドロキシル基、アミノ基、シアノ基、-O-CH(CH<sub>3</sub>)-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)基または-O-CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル)基によって置換されていてもよいフェニル基を表わす)、(置換されていてもよいフェニル(SP1)基)オキシ(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基、(置換されていてもよいフェニル(SP1)基)は前記と同様の意味を表わす。)、(置換されていてもよいフェニル(SP1)基)-Q-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基、(Qおよび置換されていてもよいフェニル(SP1)基)は前記と同様の意味を表わす。)、Het基(Het基とは酸素原子を1あるいは2個含むことを特徴とする飽和あるいは不飽和結合を含有する3~6員ヘテロ環を表わす。)または-Q-Het基(QおよびHet基は前記と同様の意味を表わす。))を表わす。)、-NH-R11(R11は前記と同様の意味を表わす。)、-S-R11(R11は前記と同様の意味を表わす。)、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>アルケニルオキシカルボニル(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>アルキニルオキシカルボニル(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基、-NHCO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルオキシカルボニル(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基、-N(R15)CO-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルオキシカルボニル(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基(R15はC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>アルケニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルキル基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>ハロアルケニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>ハロアルキニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アシル基、ホルミル基、シアノ(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル基または-C(=O)(置換されていてもよいフェニル(SP3)基)基(但し、置換されていてもよいフェニル(SP3)基は前記と同様の意味を表わす。))を表わし、R

4は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、水酸基、アミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ基またはメルカプト基を表わし、

R3とR4は酸素、窒素、硫黄、炭素原子を任意に含むことを特徴とする飽和あるいは不飽和結合を有する5~6員環を形成していてもよく、

R2とR3は式(a)から(f)に示すようなヘテロ環を形成していてもよく、

#### 【化2】



なお、式(a)から式(f)のRf、Rg、A、X、Y、Z、R1、R4およびR5は前記と同様の意味を表わし、

R17は水素原子、水酸基、アミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>アルケニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルキル基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>ハロアルケニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>ハロアルキニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アシル基、ホルミル基、ベンゾイル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルケニルオキシ基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキニルオキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ基、CH<sub>2</sub>CONH<sub>2</sub>、CH(CO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル))<sub>2</sub>基、CH<sub>2</sub>-(ビリジル)基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキルカルボニル基、フェナシル基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>シクロアルキル(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基、-Q-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基(但し、Qは前記と同様の意味を表わす。)-Q-CN基(但し、Qは前記と同様の意味を表わす。))または-Q-(置換されていてもよいフェニル(SP3)基)基(但し、Qおよび置換されていてもよいフェニル(SP3)基は前記と同様の意味を表わす。))を表わし、

R28およびR29はそれぞれ独立して水素原子、シアノ基、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルケニル基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アシル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C

<sub>4</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルチオ基または置換されていてもよいフェニル(SP3)基(置換されていてもよいフェニル(SP3)基は前記と同様の意味を表わす。)を表わし、

但し、式(a)のR28とR29がともに水素原子の場合と、式(b)のR28、R29およびR30が全て水素原子の場合を除き、R28とR29が一緒になって酸素原子を表わしていてもよく、

R30は水素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアシル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>ハロアルキル基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルケニル基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>アシル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル基またはC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基を表わし、

但し、これらの化合物に光学異性体、ジアステレオマー、幾何異性体が存在する場合は、それぞれの化合物および単離された異性体の双方を包含する。)で示される化合物およびその塩。

【請求項2】請求項1記載の化合物を有効成分とする除草剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明はヘテロ環縮合ピリミジノン誘導体を有効成分として含有する除草剤に関するものである。

【0002】

【従来の技術および課題】従来から、重要作物、例えばイネ、大豆、小麦、トウモロコシ、ワタ、ビート等を雑草害から守り、これらの重要作物の生産性を高める為に多くの除草剤が実用化されてきたが依然として既存の薬剤は求められる機能を全て満たしているものではない。

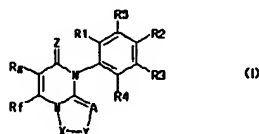
【0003】

【課題を解決する為の手段】本発明者らは、ヘテロ環縮合ピリミジノン誘導体の除草作用について鋭意検討した結果、下記式で示される本発明化合物が優れた除草作用を有することを見出し本発明を完成するに至った。

【0004】即ち、本発明は式(I)：

【0005】

【化3】



【0006】〔式中、RfはC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルキル基を表わし、XおよびYはそれぞれ独立して炭素原子、窒素原子、酸素原子または硫黄原子を表わし、X~YはN=N、C(Ra)=C(Rb)(Ra、Rbはそれぞれ独立して水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルキル

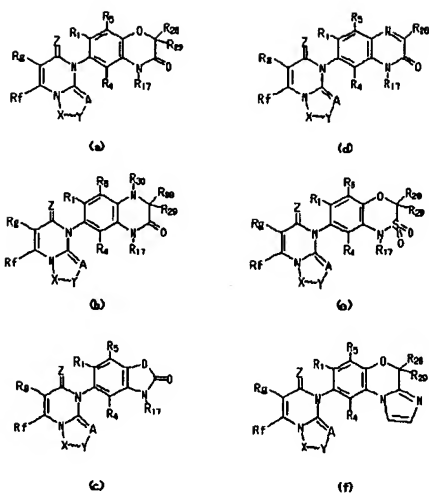
基、水酸基、アミノ基、メルカプト基、カルボキシル基、ヒドロキシメチル基、カルバモイル基、ホルミル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルカルボニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルアミノ基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルメルカプト基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニルアミノ基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルキニルアミノ基、ベンジルオキシ基、ベンジリアミノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルスルフィニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキルスルホニル基、ヒリジル基または置換されていてもよいフェニル(SP1)基(置換されていてもよいフェニル(SP1)基とは、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルコキシ基またはフェニル基によって置換されていてもよいフェニル基を表わす。)を表わす。)、C(Ra)=N(Raは前記と同様の意味を表わす。)、N=C(Ra)(Raは前記と同様の意味を表わす。)、CH(Ra)CH(Rb)(RaおよびRbは前記と同様の意味を表わす。)、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>、CH=CHCH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH=CH、NHC(Ra)Rb(RaおよびRbは前記と同様の意味を表わす。)、C(Ra)(Rb)NH(RaおよびRbは前記と同様の意味を表わす。)、C(=O)C(=O)、CH<sub>2</sub>C(=O)NH、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>、C(=O)CH(Ra)(Raは前記と同様の意味を表わす。)、CH(Ra)C(=O)(Raは前記と同様の意味を表わす。)、C(=O)NH、C(=S)NH、NHC(=O)、NHC(=S)、C(=O)C(Ra)=N(Raは前記と同様の意味を表わす。)、C(=O)C(Ra)=C(Rb)(RaおよびRbは前記と同様の意味を表わす。)、C(Ra)=C(Rb)C(=O)(RaおよびRbは前記と同様の意味を表わす。)、N=C(Ra)C(=O)(Raは前記と同様の意味を表わす。)、CH(Ra)C(=O)NH(Raは前記と同様の意味を表わす。)、C(=O)N(Ra)C(=O)(Raは前記と同様の意味を表わす。)、C(Ra)=NC(=O)(Raは前記と同様の意味を表わす。)、C(Ra)O(Raは前記と同様の意味を表わす。)、C(=O)O、OC(=O)またはSC(=O)を表わし、Aは窒素原子またはCHを表わし、Zは酸素原子、硫黄原子、NRc(Rcは水素原子、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシカルボニルメチル基または置換されていてもよいフェニル(SP2)基(置換されていてもよいフェニル(SP2)基とは、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシ基またはC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>ハロアルキル基によって置換されていてもよいフェニル基を表わす)またはNNHRC(Rcは前記と同様の意味を表わす。)を表わし、Rgは水素原子、ハロゲン原子、シアノ基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>アルケニル基、C<sub>3</sub>-

C<sub>6</sub>アルキニル基またはC<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル基を表わし、R1は水素原子またはハロゲン原子を表わし、R5は水素原子またはハロゲン原子を表わし、R2は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、チオカルバモイル基、カルバモイル基、メルカプト基、ヒドロキシル基、アミノ基、ホルミル基、カルボキシル基、ビニル基、エチニル基、トリメチルシリルエチニル基、シアノメチル基、スルファモイル基、フェニル基、ベンジル基、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>アルキル基、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>アルケニル基、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>ハロアルキル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>ハロアルコキシ基、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>ハロアルケニル基、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>ハロアルキニル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アシル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキルスルホニル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキルチオ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>)アルキル基、-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル)基、-CON(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル)<sub>2</sub>基、-CONH(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル)基、-NH-(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル)基、-N(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル)<sub>2</sub>基、-S-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル)基、-O-Q-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル)基(但し、Qは飽和あるいは不飽和の分岐していてもよく、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル基、シアノ基、フェニル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>ハロアルキル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アシル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル基あるいは酸素原子で置換されていてもよいC<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>のアルキレン鎖を表わす。)、フェニルエチル基、-Q-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル)基(但し、Qは前記と同様の意味を表わす。)、または-NH-Q-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル)基(但し、Qは前記と同様の意味を表わす。))を表わし、R3は、-O-R11(R11はC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>シクロアルケニル基、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>シクロアルケニル(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル基、シアノ(C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>)アルキル基、シアノ(フェニル)メチル基、インダニル基、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルコキシ)<sub>2</sub>(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>ハロアルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)ハロアルキル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>ハロアルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>アルケニルオキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>アルキニルオキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキルチオ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル基、ケト(C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>)シクロアルキル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アシル(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキルスルホニル(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル基、(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル)<sub>2</sub>メチル基、ピリジル(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル基、5-トリフルオロメチル-3-クロロ-2-ピリジル基、(置換されていてもよいフェニル(SP3)基)カルボニル基、(置換されていてもよいフェニル(SP1)基)とは、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>ハロアルキル基、C<sub>1</sub> -

C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>ハロアルコキシ基、メタンスルホニル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル基、ニトロ基、ヒドロキシル基、アミノ基、シアノ基、-O-CH(CH<sub>3</sub>)CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル)基または-O-CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル)基によって置換されていてもよいフェニル基を表わす。)、(置換されていてもよいフェニル(SP1)基)オキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル基、(置換されていてもよいフェニル(SP1)基)基は前記と同様の意味を表わす。)、(置換されていてもよいフェニル(SP1)基)-Q-(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル基、(Qおよび置換されていてもよいフェニル(SP1)基)基は前記と同様の意味を表わす。)、Het基(Het基とは酸素原子を1あるいは2個含むことを特徴とする飽和あるいは不飽和結合を含有する3~6員ヘテロ環を表わす。))または-Q-Het基(QおよびHet基は前記と同様の意味を表わす。))を表わす。)、-NH-R11(R11は前記と同様の意味を表わす。)、-S-R11(R11は前記と同様の意味を表わす。)、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>アルケニルオキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>アルキニルオキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル基、-NHCO-(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルオキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル基、-N(R15)CO-(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキルオキシカルボニル(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル基(R15はC<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>アルキル基、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>アルケニル基、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>ハロアルキル基、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>ハロアルケニル基、C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub>ハロアルキニル基、C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>アシル基、ホルミル基、シアノ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル基または-C(=O)(置換されていてもよいフェニル(SP3)基)基(但し、置換されていてもよいフェニル(SP3)基は前記と同様の意味を表わす。))を表わし、R4は水素原子、ハロゲン原子、ニトロ基、水酸基、アミノ基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルキル基、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>アルコキシ基またはメルカプト基を表わし、R3とR4は酸素、窒素、硫黄、炭素原子を任意に含むことを特徴とする飽和あるいは不飽和結合を有する5~6員環を形成していてもよく、R2とR3は式(a)から(f)に示すようなヘテロ環を形成していてもよく、

【0007】

【化4】



【0008】なお、式(a)から式(f)のR<sub>f</sub>、R<sub>g</sub>、A、X、Y、Z、R<sub>1</sub>、R<sub>4</sub>およびR<sub>5</sub>は前記と同様の意味を表わし、R<sub>17</sub>は水素原子、水酸基、アミノ基、C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub>アルケニル基、C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>ハロアルキル基、C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub>ハロアルケニル基、C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub>ハロアルキニル基、C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>アシル基、ホルミル基、ベンゾイル基、C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>アルコキシ基、C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub>アルケニルオキシ基、C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub>アルキニルオキシ基、C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>ハロアルコキシ基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>)アルコキシ基、CH<sub>2</sub>CONH<sub>2</sub>、CH(CO<sub>2</sub>–(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキル))<sub>2</sub>基、CH<sub>2</sub>–(ピリジル)基、C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>ハロアルキルカルボニル基、フェナシル基、C<sub>3</sub>–C<sub>8</sub>シクロアルキル(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>)アルキル基、–Q–CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>)アルキル基(但し、Qは前記と同様の意味を表わす。)–Q–CN基(但し、Qは前記と同様の意味を表わす。)または–Q–(置換されていてもよいフェニル(SP<sup>3</sup>)基)基(但し、Qおよび置換されていてもよいフェニル(SP<sup>3</sup>)基は前記と同様の意味を表わす。)を表わし、R<sub>28</sub>およびR<sub>29</sub>はそれぞれ独立して水素原子、シアノ基、ハロゲン原子、C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub>アルケニル基、C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>ハロアルキル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アシル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>)アルコキシ基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルコキシ基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>)アルキル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルキルチオ基または置換されていてもよいフェニル(SP<sup>3</sup>)基(置換されていてもよいフェニル(SP<sup>3</sup>)基は前記と同様の意味を表わす。)を表わし、但し、式(a)のR<sub>28</sub>とR<sub>29</sub>がともに水素原子の場合と、式(b)のR<sub>28</sub>、R<sub>29</sub>およびR<sub>30</sub>が全て水素原子の場合を除き、R<sub>28</sub>とR<sub>29</sub>が一緒になって酸素原子を表わしていてもよく、R<sub>30</sub>は水素原子、C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>アルキル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>ハロアルキル基、C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>ハロアルキル基、C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub>アル

ケニル基、C<sub>2</sub>–C<sub>8</sub>アルキニル基、C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>アシル基、C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルコキシカルボニル基またはC<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>アルコキシ(C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>)アルキル基を表わし、但し、これらの化合物に光学異性体、ジアステレオマー、幾何異性体が存在する場合は、それぞれの化合物および単離された異性体の双方を包含する。)で示されるヘテロ環縮合ピリミジノン誘導体(以下、本発明化合物と称する。)そしてそれらを有効成分として含有する除草剤である。

【0009】

【0010】

【発明の実施の形態】式(1)中、R<sub>f</sub>としてはCF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>Cl、CF<sub>2</sub>H、CFC1H、CF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>、またはCF<sub>2</sub>ClCF<sub>2</sub>が挙げられ、好ましくはCF<sub>3</sub>が挙げられる。

【0011】R<sub>g</sub>としてはH、F、Cl、Br、C≡N、CO<sub>2</sub>Me、CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>C≡CH、Me、Et、Pr、iso-PrまたはBuが挙げられ、好ましくはHまたはFが挙げられる。

【0012】Zとしては酸素原子、硫黄原子、NH、NMe、NEt、NPr、NBu、N-tert-Bu、NCO<sub>2</sub>Me、NCO<sub>2</sub>Et、NCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、NCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、NPh、N-(4-Cl-Phenyl)、N-(3-Cl-Phenyl)、N-(2-Cl-Phenyl)、NNHMe、NNHEt、NNHPr、NNHBu、NNH-tert-Bu、NNH-(4-Cl-Phenyl)、NNH<sub>2</sub>、NNH-(3-Cl-Phenyl)、NNH-(2-Cl-Phenyl)、NNHCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、NNHCH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、NNHPh、NNHCO<sub>2</sub>MeまたはNNHCO<sub>2</sub>Etが挙げられ、好ましくは酸素原子が挙げられる。

【0013】AとしてはCHまたはNが挙げられ、好ましくはNが挙げられる。

【0014】X~YとしてはN=N、CH=N、N=C(H)、C(Cl)=N、N=C(Cl)、C(Br)=N、N=C(Br)、CH=CH、C(Cl)=CH、CH=C(Cl)、C(Br)=CH、CH=C(Br)、C(Me)=CH、CH=C(Me)、N=C(Me)、N=C(Ph)、C(Me)=N、C(Ph)=N、C(Et)=CH、CH=C(Et)、C(Pr)=CH、CH=C(Pr)、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH(Me)、CH(Me)CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH(Et)、CH(Et)CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH(Pr)、CH(Pr)CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>、CH=CHCH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH=CH、CH<sub>2</sub>C(=O)NH、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>、C(=O)C(O=O)、CH<sub>2</sub>C(=O)、(C=O)NH、(C=S)NH、NHC(=O)、NHC(=S)、C(=O)CH=N、C(=O)CH=C(H)、CH=CHC(=O)、N=CHC(=O)、CH<sub>2</sub>C(=O)NH、C(=O)NHC(=O)、C(=O)N(Me)C(=O)、CH=NC(=O)、CH

$_2\text{O}$ 、 $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ 、 $\text{OC}(=\text{O})$ 、 $\text{SC}(=\text{O})$ または $\text{C}(=\text{O})\text{S}$ が挙げられ、好ましくは $\text{CH}=\text{N}$ 、 $\text{N}=\text{CH}$ 、 $\text{CH}=\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}$ 、 $\text{C}(\text{C}_2\text{H}_5)=\text{CH}$ 、 $\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)$ 、 $\text{CH}=\text{C}(\text{C}_2\text{H}_5)$ 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}(\text{C}_2\text{H}_5)$ 、 $\text{C}(\text{C}_2\text{H}_5\text{CH}_2\text{CH}_3)=\text{CH}$ 、または $\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)$ が挙げられ、さらに好ましくは $\text{CH}=\text{CH}$ が挙げられる。

【0015】 $\text{R}_1$ としては $\text{H}$ 、 $\text{Cl}$ 、 $\text{F}$ 、 $\text{Br}$ 、または $\text{I}$ が挙げられ、好ましくは $\text{H}$ 、 $\text{Cl}$ 、または $\text{F}$ が挙げられる。

【0016】 $\text{R}_5$ としては $\text{H}$ 、 $\text{Cl}$ 、 $\text{F}$ または $\text{Br}$ が挙げられ、好ましくは $\text{H}$ が挙げられる。

【0017】 $\text{R}_2$ としては $\text{H}$ 、 $\text{Cl}$ 、 $\text{F}$ 、 $\text{Br}$ 、 $\text{I}$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{CSNH}_2$ 、 $\text{CONH}_2$ 、 $\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{C}\equiv\text{CSiMe}_3$ 、 $\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{Me}$ 、 $\text{Et}$ 、 $\text{Pr}$ 、 $\text{iso-Pr}$ 、 $\text{O-Me}$ 、 $\text{O-Et}$ 、 $\text{SO}_2\text{NH}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{CF}_2\text{Cl}$ 、 $\text{CF}_2\text{H}$ 、 $\text{CF}_3\text{O}$ 、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{HCF}_2\text{O}$ 、 $\text{ClCH}_2$ 、 $\text{BrCH}_2$ 、 $\text{SMe}$ 、 $\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OH}$ 、 $\text{SH}$ 、 $\text{NH}_2$ 、 $\text{CHO}$ 、 $\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{CN}$ 、 $\text{NHMe}$ 、 $\text{NMe}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{Ph}$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-Cl-phenyl})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-Br-phenyl})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-Me-phenyl})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-Cl-2-(OCH(Me)CO}_2\text{Me)-phenyl})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-Me-2-(OCH(Me)CO}_2\text{Me)-phenyl})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-Cl-2-(OCH(Me)CO}_2\text{Et)-phenyl})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-Me-2-(OCH(Me)CO}_2\text{Et)-phenyl})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-Et-2-(OCH(Me)CO}_2\text{Me)-phenyl})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-Et-2-(OCH(Me)CO}_2\text{Et)-phenyl})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-Pr-2-(OCH(Me)CO}_2\text{Me)-phenyl})$ 、 $\text{OCH}_2(4\text{-Pr-2-(OCH(Me)CO}_2\text{Et)-phenyl})$ 、 $\text{C}\equiv\text{CPh}$ 、 $\text{CH}=\text{CHCO}_2\text{Et}$ 、 $\text{NHCH}_2\text{Ph}$ 、 $\text{NHCH}_2(4\text{-Cl-phenyl})$ 、 $\text{NHCH}_2(4\text{-Br-phenyl})$ 、 $\text{NHCH}_2(4\text{-Me-phenyl})$ 、 $\text{NHCH}_2(4\text{-Cl-2-(OCH(Me)CO}_2\text{Me)-phenyl})$ 、 $\text{NHCH}_2(4\text{-Me-2-(OCH(Me)CO}_2\text{Me)-phenyl})$ 、 $\text{SCH}_2\text{Ph}$ 、 $\text{SCH}_2(4\text{-Cl-phenyl})$ 、 $\text{SCH}_2(4\text{-Br-phenyl})$ 、 $\text{SCH}_2(4\text{-Me-phenyl})$ 、 $\text{SCH}_2(4\text{-Cl-2-(OCH(Me)CO}_2\text{Me)-phenyl})$ 、 $\text{SCH}_2(4\text{-Me-2-(OCH(Me)CO}_2\text{Me)-phenyl})$ 、 $\text{OCH(Me)CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCH(Me)CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{NHCH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{NHCH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{SCH}_2\text{CO}_2\text{M}$

$\text{e}$ または $\text{SCH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ が挙げられ、好ましくは $\text{F}$ 、 $\text{Cl}$ 、 $\text{Br}$ 、 $\text{I}$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{NO}_2$ または $\text{CSNH}_2$ が挙げられる。

【0018】 $\text{R}_3$ としては、 $\text{OCH}_2\text{SMe}$ 、 $\text{O-(tetrahydrofuran-3-yl)}$ 、 $\text{O-(2,3-epoxypropyl)}$ 、 $\text{O-(3-Cl-5-CF}_3\text{-2-pyridyl)}$ 、 $\text{OCH}_2\text{OCH}_2\text{Ph}$ 、 $\text{O-(tetrahydrofuran-2-yl)}$ 、 $\text{OCH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{OC}(=\text{O})(4\text{-MeO-Phenyl})$ 、 $\text{OC}(=\text{O})(4\text{-F-Phenyl})$ 、 $\text{OCH}_2\text{-(tetrahydrofuran-2-yl)}$ 、 $\text{OCH}_2\text{-(2,2-dimethyl-1,3-dioxolane-4-yl)}$ 、 $\text{OCH(CH}_2\text{OEt)}_2$ 、 $\text{-OCH}_2\text{-(tetrahydropyran-2-yl)}$ 、 $\text{OCH(CO}_2\text{Et)}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{-(2-furyl)}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{SMe}$ 、 $\text{O-(2-cyclohexen-1-yl)}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OPh}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{O-(2-Cl-phenyl)}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH(Me)OPh}$ 、 $\text{OCH(Me)CH}_2\text{OPh}$ 、 $\text{OCH}_2\text{-(tetrahydrofuran-3-yl)}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OEt}$ 、 $\text{O-(indan-2-yl)}$ 、 $\text{O-(indan-1-yl)}$ 、 $\text{O-(tetrahydropyran-4-yl)}$ 、 $\text{OCH(CH}_2\text{Cl)CH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{-(2H,3H-benzo[e]1,4-dioxin-2-yl)}$ 、 $\text{OCH}_2\text{COMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{COEt}$ 、 $\text{OCH}_2\text{COPr}$ 、 $\text{OCH}_2\text{-(2-pyridyl)}$ 、 $\text{OCH}_2\text{-(3-pyridyl)}$ 、 $\text{OCH}_2\text{-(3-methyloxetan-3-yl)}$ 、 $\text{OCH(Ph)C}\equiv\text{N}$ 、 $\text{OCH(Me)C}\equiv\text{N}$ 、 $\text{OCH(Et)C}\equiv\text{N}$ 、 $\text{OCH}_2\text{-(cyclohex-3-enyl)}$ 、 $\text{OCH(Pr)C}\equiv\text{N}$ 、 $\text{OCH(Me)COMe}$ 、 $\text{OCH(Et)COMe}$ 、 $\text{OCH(Pr)COMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$ 、 $\text{OCH(Me)COEt}$ 、 $\text{OCH(Me)COPr}$ 、 $\text{O-(cyclohexan-1-one-2-yl)}$ 、 $\text{N(COCF}_3\text{)CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{N(COPh)CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{NHCOCH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{Me}$ 、 $\text{N(COCH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{Me)CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CO}_2\text{C(Me)}_2\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ または $\text{C}(=\text{O})\text{NHCH(Me)Ph}$ が挙げられる。

【0019】 $\text{R}_4$ としては $\text{H}$ 、 $\text{F}$ 、 $\text{Cl}$ 、 $\text{Me}$ 、 $\text{Et}$ 、 $\text{Pr}$ 、 $\text{iso-Pr}$ 、 $\text{MeO}$ 、 $\text{EtO}$ 、 $\text{PrO}$ 、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{NH}_2$ 、 $\text{NHCO-tert-Bu}$ 、 $\text{CH}_2\text{C(Me)=CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $2,3\text{-エポキシプロピル}$ または $2,3\text{-エポキシプロピル}$ が挙げられ、好ましくは $\text{H}$ または $\text{F}$ が挙げ



られる。なお、R4が2, 3-エポキシ-2-メチルプロピルまたは $\text{CH}_2\text{C}(\text{Me})=\text{CH}_2$ のときは、R3としては酸素原子でフェニル基に結合している置換基が挙げられる。

【0020】R2とR3は環を巻いていてもよく、その場合-R2~R3-は-OC(R28)(R29)C(=O)N(R17)-、-OC(=O)N(R17)-、-N=C(R28)C(=O)N(R17)-、-OC(R28)(R29)SO<sub>2</sub>N(R17)-、-OC(R28)(R29)C(=NCH=C(R17))-N-、-SC(=O)N(R17)-または-N(R30)C(R28)(R29)C(=O)N(R17)-が挙げられる。好ましくは、-OC(R28)(R29)C(=O)N(R17)-が挙げられる。

【0021】R17としては以下の置換基が挙げられる。Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、H、NH<sub>2</sub>、OH、CH<sub>2</sub>CONH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>cyclo-Pr、CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me、CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Et、COMe、COEt、COPr、CO-iso-Pr、COBu、CO-tert-Bu、CO-cyclo-Pr、COCF<sub>3</sub>、CH(Me)CO<sub>2</sub>Me、CH(Me)CO<sub>2</sub>Et、CH<sub>2</sub>Ph、CH<sub>2</sub>-(2-Cl-Phenyl)、CH<sub>2</sub>-(3-Cl-Phenyl)、CH<sub>2</sub>-(4-Cl-Phenyl)、CH<sub>2</sub>-(2-pyridyl)、CH<sub>2</sub>-(3-pyridyl)、CH<sub>2</sub>-(4-pyridyl)、CH(CO<sub>2</sub>Et)<sub>2</sub>、CH(CO<sub>2</sub>Me)<sub>2</sub>、OPr、O-iso-Pr、OBu、O-tert-Bu、OCH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、OCH(Me)CH=CH<sub>2</sub>、OC(Me)<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>C≡CH、OCH(Me)C≡CH、OC(Me)<sub>2</sub>C≡CH、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl、OCH(CH<sub>2</sub>F)<sub>2</sub>、OCH<sub>2</sub>OMe、OCH<sub>2</sub>OEt、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OEt、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe、CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>C≡CH、CH<sub>2</sub>C≡N、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F、CH<sub>2</sub>OMe、OMe、OEt、CH<sub>2</sub>OEt、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F、CH<sub>2</sub>CCl=CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CBr=CH<sub>2</sub>、CH(Me)C≡CH、CH(Me)CH=CH<sub>2</sub>またはCH(Me)C≡N。

【0022】R28およびR29としては、それぞれ独立して以下の置換基が挙げられる。H、C≡N、F、Cl、Br、I、Me、Et、Pr、iso-Pr、Bu、sec-Bu、iso-Bu、tert-Bu、CH=CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CH(Me)CH=CH<sub>2</sub>、C(Me)<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CH(Et)CH=CH<sub>2</sub>、C≡CH、CH<sub>2</sub>C≡CH、CH(Me)C≡CH、C(Me)<sub>2</sub>C≡CH、CH(Et)C≡CH、CH(Pr)C≡CH、CF<sub>3</sub>、CF<sub>2</sub>Cl、CH<sub>2</sub>Cl、

CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F、CHCl<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl、COMe、COEt、COPr、CO-tert-Bu、OMe、OEt、OPr、O-iso-Pr、OBu、O-iso-Bu、O-sec-Bu、O-tert-Bu、CO<sub>2</sub>Me、CO<sub>2</sub>Et、CO<sub>2</sub>Pr、CO<sub>2</sub>-iso-Pr、CO<sub>2</sub>-tert-Bu、CH<sub>2</sub>OMe、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OEt、OCH<sub>2</sub>OMe、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe、CH<sub>2</sub>SMe、Ph、2-Cl-Ph、3-Cl-Ph、4-Cl-Ph、2-F-Ph、3-F-Ph、4-F-Phまたは4-Me-Ph。

【0023】R28とR29が一緒になった場合、酸素原子が挙げられる。

【0024】R30としてはH、Me、Et、Pr、CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>C≡CH、CH(Me)C≡CH、COMe、COEt、COPr、CO-tert-Bu、CO<sub>2</sub>Me、CO<sub>2</sub>Et、CH<sub>2</sub>OMe、CH<sub>2</sub>OEt、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMeまたはCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OEtが挙げられる。

【0025】R3とR4は環を巻いていてもよく、その場合、-R4~R3-としては-CH=CH-CH<sub>2</sub>-O-、-CH=CH-O-、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-、-O-CH=CH-、-O-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-、-CH=C(Me)-O-、-O-C(Me)=CH-、-O-CH<sub>2</sub>C(=O)N(CH<sub>2</sub>C≡CH)-、-OCH<sub>2</sub>C(=O)NH-、-CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>NH-、-CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>N(COMe)-、-CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>N(CH<sub>2</sub>C≡CH)-、-O(C=O)N(CH<sub>2</sub>C≡CH)-、-S-C(Me)=N-、-O-C(Me)=N-、-S-CH=N-、-O-CH=N-または-O-C(Me)<sub>2</sub>-O-が挙げられる。

【0026】なお、文中の記号は以下の意味を表す。

Me: CH<sub>3</sub>

Et: CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

Pr: CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

iso-Pr: CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>

cyclo-Pr: CH(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>

Bu: CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

sec-Bu: CH(CH<sub>3</sub>)C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>

iso-Bu: CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>

tert-Bu: C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>

cyclo-Bu: CH(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>

Pn: CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

cyclo-Pn: CH(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>

iso-Pn: CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>

neo-Pn: CH<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>

cyclo-Hex: CH(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>

tert-Pn: C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>

Hex: (CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>CH<sub>3</sub>

Hep:  $(\text{CH}_2)_8\text{CH}_3$

Oct:  $(\text{CH}_2)_7\text{CH}_3$

Ph, Phenyl:  $\text{C}_6\text{H}_5$

4-Cl-Ph: 4-Cl-Phenyl

本発明化合物のあるものは畑地、非耕地用除草剤として、土壌処理、茎葉処理のいずれの処理方法に於いても、イヌホウズキ (*Solanum nigrum*)、チョウセンアサガオ (*Datura stramonium*) 等に代表されるナス科 (*Solanaceae*) 雑草、イチビ (*Abutilon theophrasti*)、アメリカキンゴジカ (*Sida spinosa*) 等に代表されるアオイ科 (*Malvaceae*) 雑草、マルバアサガオ (*Ipomoea purpurea*) 等のアサガオ類 (*Ipomoea* spp.) やヒルガオ類 (*Calystegia* spp.) 等に代表されるヒルガオ科 (*Convolvulaceae*) 雑草、イヌビユ (*Amaranthus lividus*)、アオビユ (*Amaranthus retroflexus*) 等に代表されるヒユ科 (*Amaranthaceae*) 雑草、オナモミ (*Xanthium pensylvanicum*)、ブタクサ (*Ambrosia artemisiifolia*)、ヒマワリ (*Helianthus annuus*)、ハキダメギク (*Galinsoga ciliata*)、セイヨウトゲアザミ (*Cirsium arvense*)、ノボロギク (*Senecio vulgaris*)、ヒメジョオン (*Erigeron annuus*) 等に代表されるキク科 (*Compositae*) 雑草、イヌガラシ (*Rorippa indica*)、ノハラガラシ (*Sinapis arvensis*)、ナズナ (*Capsella Bursapastoris*) 等に代表されるアブラナ科 (*Cruciferae*) 雑草、イヌタデ (*Polygonum Blumei*)、ソバカズラ (*Polygonum convolvulus*) 等に代表されるタデ科 (*Polygonaceae*) 雑草、スベリヒユ (*Portulaca oleracea*) 等に代表されるスベリヒユ科 (*Portulacaceae*) 雑草、シロザ (*Chenopodium album*)、コアカザ (*Chenopodium ficifolium*)、ホウキギ (*Kochia scoparia*) 等に代表されるアカザ科 (*Chenopodiaceae*) 雑草、ハコベ (*Stellaria media*) 等に代表されるナデシコ科 (*Caryophyllaceae*) 雑草、オオイヌノフグリ (*Veronica persica*) 等に代表されるゴマノハグサ科 (*Scrophulariaceae*) 雑草、ツユクサ (*Commelina communis*) 等に代表されるツユクサ科 (*Commelinaceae*) 雑草、ホトケノザ (*Lamium amplexicaule*)、ヒメオドリコソウ (*Lamium purpureum*) 等に代表されるシソ科 (*Labiatae*) 雑草、コニシキソウ (*Euphorbia supina*)、オオニシキソウ (*Euphorbia maculata*) 等に代表されるトウダイグサ科 (*Euphorbiaceae*) 雑草、ヤエムグラ (*Galium spurium*)、アカネ (*Rubia akane*) 等に代表されるアカネ科 (*Rubiaceae*) 雑草、スミレ (*Viola mandshurica*) 等に代表されるスミレ科 (*Violaceae*) 雑草、アメリカツノクサネム (*Sesbania exaltata*)、エビスグサ (*Cassia obtusifolia*) 等に代表されるマメ科 (*Leguminosae*) 雑草等の広葉雑草 (Broad-leaved weeds)、野生ソルガム (*Sorghum bicolor*)、オオクサキビ (*Panicum dichotomiflorum*)、ジョンソングラス (*Sorghum halepense*)、イヌビエ (*Echinochloa crus-galli* var. *crus-galli*)、ヒメイヌビエ (*Echinochloa crus-galli* var. *pratensis*)、栽培ビエ (*Echinochloa utilis*)、メヒシバ (*Digitaria adscendens*)、カラスムギ (*Avenafatua*)、オヒシバ (*Eleusine indica*)、エノコログサ (*Setaria viridis*)、スズメノテッポウ (*Alopecurus aequalis*) 等に代表されるイネ科雑草 (Gramineous weeds)、ハマスゲ (*Cyperus rotundus*, *Cyperus esculentus*) 等に代表されるカヤツリグサ科雑草 (Cyperaceous weeds) 等の各種畑地雑草 (Cropland weeds) に低薬量で高い殺草力を有する。

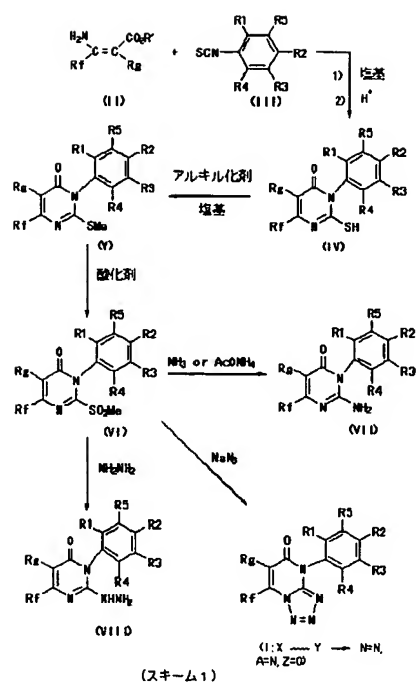
【0027】又、水田用除草剤として湛水下の土壌処理および茎葉処理のいずれの処理方法に於いても、ヘラオモダカ (*Alisma canaliculatum*)、オモダカ (*Sagittaria trifolia*)、ウリカワ (*Sagittaria pygmaea*) 等に代表されるオモダカ科 (*Alismataceae*) 雑草、タマガヤツリ (*Cyperus difformis*)、ミズガヤツリ (*Cyperus serotinus*)、ホタルイ (*Scirpus juncoides*)、クログワイ (*Eleocharis kuroguwai*) 等に代表されるカヤツリグサ科 (*Cyperaceae*) 雑草、アゼナ (*Lindernia pyxidaria*) 等に代表されるゴマノハグサ科 (*Scrophulariaceae*) 雑草、コナギ (*Monochoria vaginalis*) 等に代表されるミズアオイ科 (*Potamogetonaceae*) 雑草、ヒルムシロ (*Potamogeton distinctus*) 等に代表されるヒルムシロ科 (*Potamogetonaceae*) 雑草、キカシグサ (*Rotala indica*) 等に代表されるミソハギ科 (*Lythraceae*) 雑草、タイヌビエ (*Echinochloa oryzicola*)、ヒメタイヌビエ (*Echinochloa crus-galli* var. *formosensis*)、イヌビエ (*Echinochloa crus-galli* var. *crus-galli*) 雑草等、各種、水田雑草 (Paddy weeds) に低薬量で高い殺草力を有する。

【0028】さらに本発明化合物のあるものは、重要作物であるイネ、コムギ、オオムギ、ソルゴー、落花生、トウモロコシ、大豆、棉、ビート等に対して高い安全性を有する。

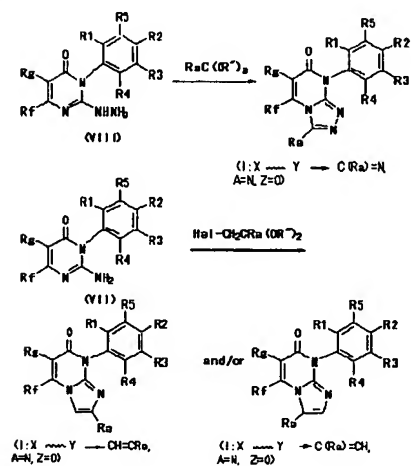
【0029】本発明化合物は例えばスキーム1から15に示す方法によって合成することができる (スキーム1から15のZ、A、Ra、Rc、Rf、RgおよびR1~R5は前記と同様の意味を表し、R' およびR'' はそれぞれ独立してC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基を表し、Halはハロゲン原子を表し、nは2あるいは3の整数を表わす。)

【0030】

【化5】

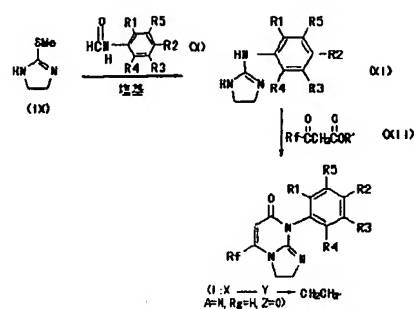


【0031】  
【化6】

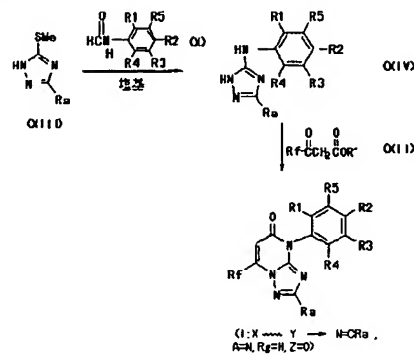


(スキーム2)

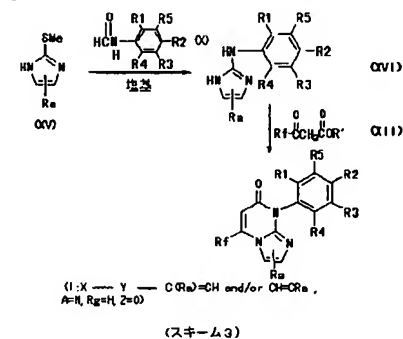
【0032】  
【化7】



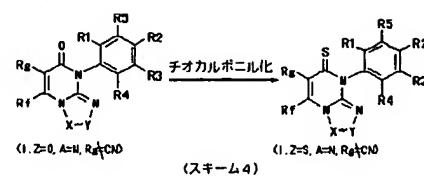
【0033】  
【化8】



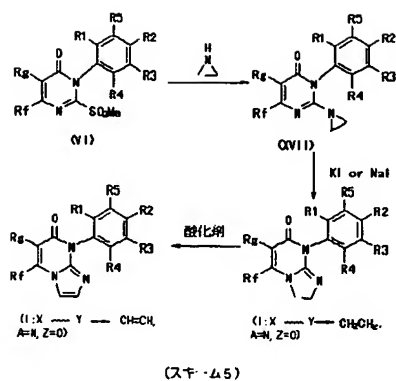
【0034】  
【化9】



【0035】  
【化10】

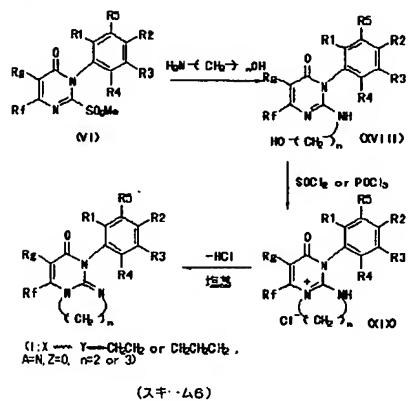


【0036】  
【化11】



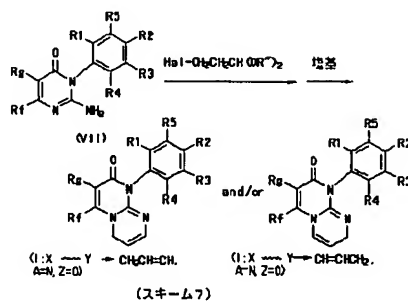
【0037】

【化12】



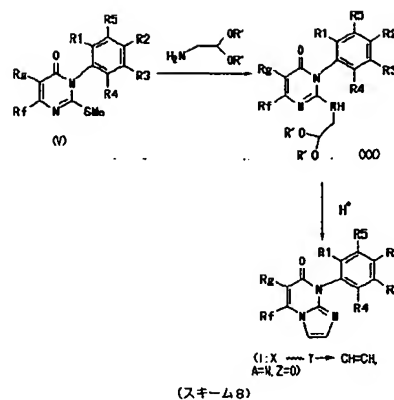
【0038】

【化13】



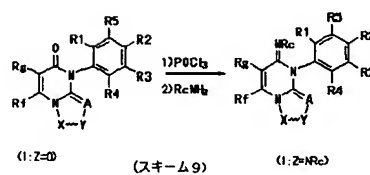
【0039】

【化14】



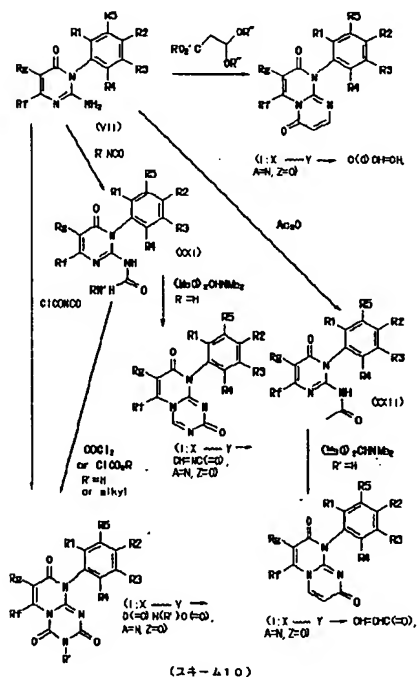
【0040】

【化15】



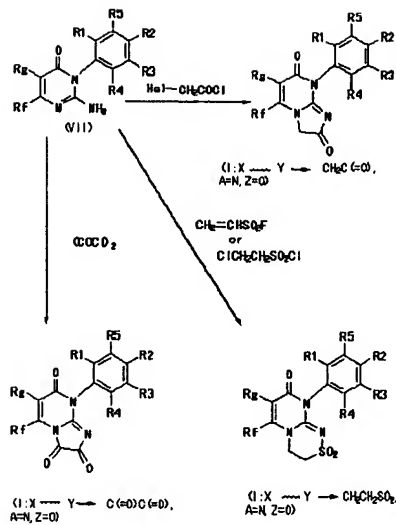
【0041】

【化16】



【0042】

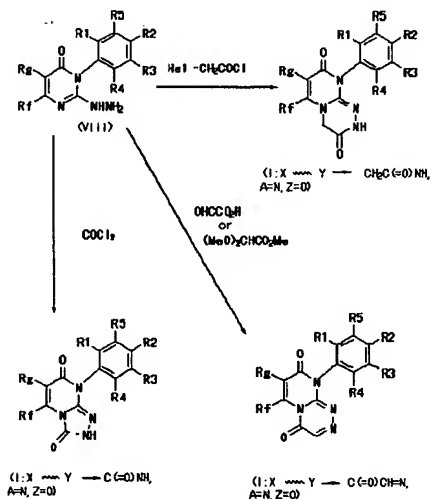
【化17】



(スキーム 11)

【0043】

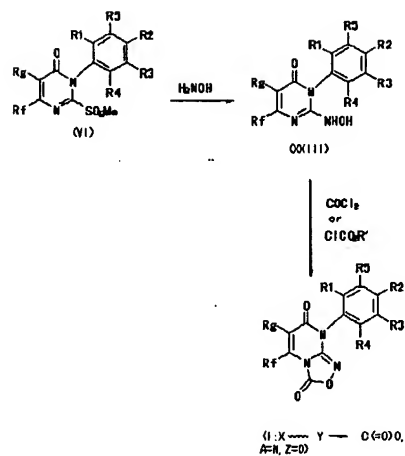
【化18】



(スキーム 12)

【0044】

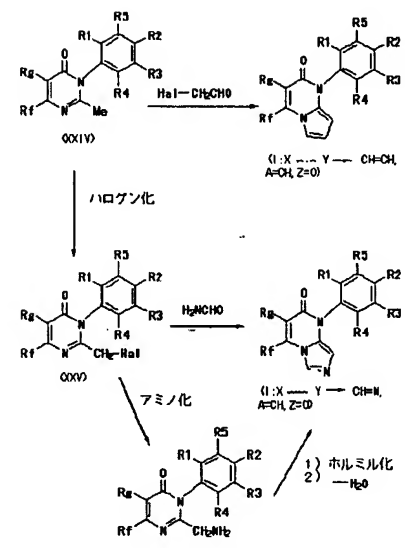
【化19】



(スキーム 13)

【0045】

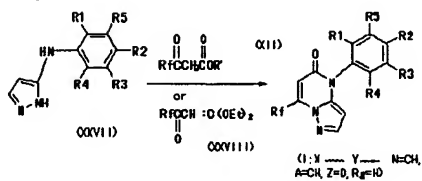
【化20】



(スキーム 14)

【0046】

【化21】



(スキーム 15)

【0047】(スキーム1) アミノクロトン酸エステル誘導体(II)とフェニルイソチオシアレート誘導体(III)を塩基の存在下、不活性溶媒中で反応させ、2-メルカプトピリミジン誘導体(IV)を得ることができる。

【0048】化合物(II)は、J. Org. Chem., 21, 1358-61 (1956); J. Heterocycl. Chem., 513 (1972); Zhur. Org. Kim., 22(8), 1603-9 (1986); 特開平5-140060号公報などを参考に合成できる。化合物(III)は対応するアニリン誘導体からSandler, S. R., Karo, W. "Organic Functional Group Preparations" Academic, New York, 1968, Vol. 1, pp312-315に記載の方法に準じて調製することができる。

【0049】化合物(IV)を例えばジメチル硫酸やヨウ化メチルのようなアルキル化剤(アルキルとしてMe, Etなどが好ましい)と塩基存在下反応させることにより、例えば、2-メチルメルカプトピリミジン誘導体(V)を合成できる。化合物(V)を例えば、過酸化水素、空気、メタクロル過安息香酸などの酸化剤を用いて2-メタンスルホニルピリミジン誘導体(VI)へ誘導することができる。化合物(VI)をアジ化ナトリウム(アジ化カリウムあるいはトリメチルシリルアジドでもよい。)と反応させ、本発明化合物(I:  $X \sim Y \rightarrow N = N$ , A=N, Z=Oの場合)を合成できる。

【0050】化合物(VI)をアンモニアあるいは酢酸アンモニウムと反応させ2-アミノピリミジン誘導体(VII)へ、またヒドラジンと反応させ2-ヒドラジノピリミジン誘導体(VIII)へとそれぞれ導くことができる。

【0051】但し、反応条件を強くすることにより、化合物(VI)の代わりに化合物(V)を用いて化合物(VII)、(VIII)または(I:  $X \sim Y \rightarrow N = N$ , A=N, Z=Oの場合)を合成することもできる。(スキーム2)化合物(VIII)を、例えば"Comprehensive Heterocyclic Chemistry" Vol. 5, Part 4A, 890に記載されている方法を参考にして、オルトエステル誘導体と反応させ本発明化合物(I:  $X \sim Y \rightarrow C(Ra) = N$ , A=N, Z=Oの場合)を合成できる。

【0052】化合物(VII)をChem. Pharm. Bull. 40(1) 235-237 (1992)などを参考にハロゲンアセトアルデヒドジアルキルアセタール誘導体(ハロゲン原子として塩素原子と臭素原子が好ましい。)と反応させ本発明化合物(I:  $X \sim Y \rightarrow CH = CRa$ , A=N, Z=Oの場合)と、あるいは、本発明化合物(I:  $X \sim Y \rightarrow C(Ra) = CH$ , A=N, Z=Oの場合)を合成することができる。

(スキーム3) スードチオウレア(IX)とホルミルアニリン誘導体(X)からグアニジン誘導体(XI)へと導く。さらに化合物(XI)をβ-ケート酸エステル誘導体(XII)とHelvetica Chimica Acta, Vol. 59, Fasc. 4 (1976) p

p1203-1212などに記載の方法を参考にして本発明化合物(I:  $X \sim Y \rightarrow CH_2CH_2$ , A=N, Rg=H, Z=Oの場合)を得ることができる。

【0053】メチルメルカプト基を持った1, 2, 4-トリアゾール(XIII)とイミダゾール(XV)を、それぞれホルミルアニリン誘導体(X)と反応させ化合物(XIV)と(XVI)を合成することができる。引き続き、これらと、β-ケートエステル誘導体(XII)をそれぞれ反応させることによって、本発明化合物(I:  $X \sim Y \rightarrow N = CRa$ , A=N, Rg=H, Z=Oの場合)および本発明化合物(I:  $X \sim Y \rightarrow C(Ra) = CH$  and/or  $CH = CRa$ , A=N, Rg=H, Z=Oの場合)を合成することができる。場合によっては、(XIII)や(XV)のMeS基を酸化し、MeSO<sub>2</sub>基として反応に供する事もできる。

(スキーム4) 化合物(I: Z=O, A=N, Rg≠CNの場合)を五硫化リン(P<sub>2</sub>S<sub>5</sub>)あるいはローソン試薬(Lawesson's Reagent: 2, 4-bis(4-methoxyphenyl)-1, 3-dithia-2, 4-diphosphetane-2, 4-disulfide)といったチオカルボニル化剤と反応させ本発明化合物(I: Z=S, A=N, Rg≠CNの場合)を合成することができる。

(スキーム5) 化合物(VI)とアジリジンから調製した化合物(XVII)を、例えばJ. Org. Chem., Vol. 39, No. 24, 3508 (1974)などの方法を参考にしてヨウ化ナトリウムあるいはヨウ化カリウム存在下反応させ本発明化合物(I:  $X \sim Y \rightarrow CH_2CH_2$ , A=N, Z=Oの場合)を合成できる。引き続き適当な酸化剤、例えば空気、NaOCl、DDQ、過マンガン酸カリウムあるいはクロラニル(chloranil)などを用い本発明化合物(I:  $X \sim Y \rightarrow CH = CH$ , A=N, Z=Oの場合)へと導くことができる。

(スキーム6) YAKUGAKU ZASSHI, 94(12) pp1503-1514 (1974)などに記載の方法を参考にして、化合物(VI)とアミノアルコールより得られた化合物(XVIII)を、塩化チオニルあるいはオキシ塩化リンと反応させ、化合物(XIX)を得る。これを例えばDBU、ピリジン、KOH、ソジウムメトキシドのような塩基と反応させ本発明化合物(I:  $X \sim Y \rightarrow CH_2CH_2$  or  $CH_2CH_2CH_2$ , A=N, Z=O, n=2 or 3の場合)を得ることができる。

【0054】本反応に用いるアミノアルコールの炭素原子にメチル、フェニルといった置換基の入ったものを使えば本発明化合物のX~Yのメチレン部分に対応した置換基を導入することができる。

(スキーム7) 化合物(VII)をハロゲンプロピルアルデヒド ジアルキルアセタール(ハロゲンは塩素、臭

素が好ましい。)と反応後、塩基で処理し、本発明化合物 ( $I: X \sim Y \rightarrow CH_2CH=CH$ ,  $A=N$ ,  $Z=O$  の場合)と、あるいは本発明化合物 ( $I: X \sim Y \rightarrow CH=CHCH_2$ ,  $A=N$ ,  $Z=O$  の場合)を合成できる。

(スキーム8)化合物(V)をアミノアセトアルデヒドジアルキルアセタール誘導体と、例えばJ. Heterocyclic Chem., 26, 205-207 (1989)を参考に反応させ、2位へ2, 2-ジアルコキシエチルアミノ基を導入し、化合物(XX)を合成できる。さらに化合物(XX)を酸性条件下、例えば、濃硫酸、メタンスルホン酸、ポリリン酸、濃塩酸、パラトルエンスルホン酸等の存在下、閉環反応によって本発明化合物 ( $I: X \sim Y \rightarrow CH=CH$ ,  $A=N$ ,  $Z=O$  の場合)を合成することができる。

(スキーム9)化合物 ( $I: Z=O$  の場合)を、例えばEP168262等を参考に、オキシ塩化リンと反応後 $NH_2-Rc$ と反応させて本発明化合物 ( $I: Z=NRc$  の場合)を合成することができる。

(スキーム10)化合物(VII)をイソシアナ酸塩 $R'NCO$  ( $R'$ としてはカリウム、ナトリウムまたはアンモニウムが好ましい。)あるいはアルキルイソシアナート $R'NCO$  ( $R'$ としては、メチル、エチル、プロピルなどが挙げられる。)と反応させ、ウレア誘導体(XXI)を合成することができる。化合物(XXI)をジメチルホルムアミドジメチルアセタールと反応させ、本発明化合物 ( $I: X \sim Y \rightarrow CH=NC(=O)$ ,  $A=N$ ,  $Z=O$  の場合)を合成することができる。

【0055】化合物(XXI)を、例えばホスゲン、ホスゲンダイマー、トリホスゲンなどのホスゲン誘導体あるいはクロロギ酸エステルと反応させ、本発明化合物 ( $I: X \sim Y \rightarrow C(=O)N(R')C(=O)$ ,  $A=N$ ,  $Z=O$  の場合)を合成することができる。

【0056】化合物(VII)を3, 3-ジアルコキシプロピオン酸誘導体と反応させ、本発明化合物 ( $I: X \sim Y \rightarrow C(=O)CH=CH$ ,  $A=N$ ,  $Z=O$  の場合)を合成することができる。

【0057】尚、化合物(VII)とクロロカルボニルイソシアナートを、例えばBull. Chem. Soc. Jpn., 61, 2217-2219 (1988)などを参考に反応させることにより、一気に本発明化合物 ( $I: X \sim Y \rightarrow C(=O)NHC(=O)$ ,  $A=N$ ,  $Z=O$  の場合)を合成することができる。

【0058】化合物(VII)を無水酢酸あるいはアセチルクロライドと反応させ、アセトアミド誘導体(XXII)へと導くことができる。化合物(XXII)をDMFジメチルアセタールと反応させ、本発明化合物 ( $I: X \sim Y \rightarrow CH=CHC(=O)$ ,  $A=N$ ,  $Z=O$  の場合)を合成することができる。

(スキーム11)化合物(VII)をクロロ酢酸クロライドあるいはブロモ酢酸クロライドと反応させ、本発明

化合物 ( $I: X \sim Y \rightarrow CH_2C(=O)$ ,  $A=N$ ,  $Z=O$  の場合)を合成することができる。

【0059】化合物(VII)をオキサリクロライドと反応させ、本発明化合物 ( $I: X \sim Y \rightarrow C(=O)C(=O)$ ,  $A=N$ ,  $Z=O$  の場合)を合成することができる。

【0060】化合物(VII)とエテンスルホニルフルオリドあるいはクロロエチルスルホニルクロライドとを、例えばJ. Org. Chem., Vol. 44, No. 22, 3847-3858 (1979)などを参考に反応させることにより、本発明化合物 ( $I: X \sim Y \rightarrow CH_2CH_2SO_2$ ,  $A=N$ ,  $Z=O$  の場合)を合成することができる。

(スキーム12)化合物(VIII)をクロロ酢酸クロライドあるいはブロモ酢酸クロライドと反応させ、本発明化合物 ( $I: X \sim Y \rightarrow CH_2C(=O)NH$ ,  $A=N$ ,  $Z=O$  の場合)を合成することができる。

【0061】化合物(VIII)をグリオキシル酸(エステル体でもよい)あるいはグリオキシル酸ジメチルアセタールと反応させ、本発明化合物 ( $I: X \sim Y \rightarrow C(=O)CH=N$ ,  $A=N$ ,  $Z=O$  の場合)を合成することができる。

【0062】化合物(VIII)を、例えばホスゲン、ホスゲンダイマー、トリホスゲンなどのホスゲン誘導体と反応させ、本発明化合物 ( $I: X \sim Y \rightarrow C(=O)NH$ ,  $A=N$ ,  $Z=O$  の場合)を合成することができる。

(スキーム13)化合物(VI)とヒドロキシルアミンとを反応させ化合物(XXIII)とした後、引き続き例えばホスゲン、ホスゲンダイマー、トリホスゲンなどのホスゲン誘導体あるいはクロロギ酸エステルと反応させることにより、本発明化合物 ( $I: X \sim Y \rightarrow C(=O)O$ ,  $A=N$ ,  $Z=O$  の場合)を合成することができる。

(スキーム14)化合物(XXIV)とブロモアセトアルデヒドあるいはクロロアセトアルデヒドとを、例えばJ. Org. Chem., Vol. 42, No. 14, 2448-2454 (1977)などを参考に反応させることにより、本発明化合物 ( $I: X \sim Y \rightarrow CH=CH$ ,  $A=CH$ ,  $Z=O$  の場合)を合成することができる。

【0063】化合物(XXIV)をハロゲン化剤、例えばNBS、NCS、塩素あるいは臭素と、BPOまたはAIBN存在下で反応させることによりハロゲノメチル化合物(XXV)を合成し、引き続きホルムアミドと反応させて脱水環化させ本発明化合物 ( $I: X \sim Y \rightarrow CH=N$ ,  $A=CH$ ,  $Z=O$  の場合)を合成することができる。

【0064】あるいは、化合物(XXV)にアミノ基を導入し、化合物(XXVI)を得た後、例えばUSP 4, 044, 015などを参考にギ酸によってホル

ミル化した後、オキシ塩化リンで脱水して、本発明化合物(I:  $X \sim Y \rightarrow CH=N$ ,  $A=CH$ ,  $Z=O$ の場合)を合成することができる。

(スキーム15)化合物(XXVII)と $\beta$ -ケト酸エステル誘導体(XII)あるいは2,2-エトキシビニルハロアルキルケトン(XXVIII)とを反応させ、本発明化合物(I:  $X \sim Y \rightarrow N=CH$ ,  $A=CH$ ,  $Z=O$ ,  $Rg=H$ の場合)を合成することができる。

【0065】スキーム中の化合物(V)あるいは(VI)のメチルメルカプト基、メタンスルホニル基をそれぞれ脱離基として、次の反応に用いているが、脱離基として塩素原子の入った化合物を用いて反応を行ってもよい。

【0066】

【実施例】以下に本発明化合物および中間体の合成例を実施例として具体的に述べるが、本発明はこれらによって限定されるものではない。

【実施例1】8-〔2,7-ジフルオロ-3,4-ジヒドロ-3-オキソ-4-(2-プロピニル)-2H-1,4-ベンゾオキサジン-6-イル〕-7,8-ジヒドロ-5-トリフルオロメチルイミダゾ〔1,2-a〕ピリミジン-7-オン(本発明化合物No. 244)の合成

【0067】

【化22】



【0068】8-〔2,7-ジフルオロ-3,4-ジヒドロ-3-オキソ-2H-1,4-ベンゾオキサジン-6-イル〕-7,8-ジヒドロ-5-トリフルオロメチルイミダゾ〔1,2-a〕ピリミジン-7-オン0.6g、プロパルギルブロミド1.0g、炭酸カリウム0.6g、アセトニトリル30mlの混合物を3時間加熱還流した。溶媒を減圧留去し、飽和食塩水200mlを加え、酢酸エチルで抽出した。抽出層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去後、シリカゲル分取薄層板(展開溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン=1/1)で精製し、0.45gの目的物を白色結晶として得た。

$^1H$ -NMR (ppm) 2.23~2.24 (m, 1H), 4.61~4.77 (m, 2H), 6.06 (d,  $J=5.0$  Hz, 1H), 6.64 (s, 1H),

7.02~7.40 (m, 4H) [ $CDCl_3$ ]

mp 102~104°C

【実施例2】8-〔3,4-ジヒドロ-3-オキソ-4-(2-プロピニル)-2,2,7-トリフルオロ-2H-1,4-ベンゾオキサジン-6-イル〕-7,8-ジヒドロ-5-トリフルオロメチルイミダゾ〔1,2-a〕ピリミジン-7-オン(本発明化合物No. 245)の合成

【0069】

【化23】



【0070】8-〔3,4-ジヒドロ-3-オキソ-2,2,7-トリフルオロ-2H-1,4-ベンゾオキサジン-6-イル〕-7,8-ジヒドロ-5-トリフルオロメチルイミダゾ〔1,2-a〕ピリミジン-7-オン0.3g、プロパルギルブロミド0.7g、炭酸カリウム0.3g、ジメチルホルムアミド10mlの混合物を130°Cで30分攪拌した。混合物を飽和食塩水100ml中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。抽出層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去後、シリカゲル分取薄層板(展開溶媒: 酢酸エチル/ヘキサン=1/1)で精製し、0.12gの目的物を淡黄色結晶として得た。

$^1H$ -NMR (ppm) 2.39~2.42 (m, 1H), 4.65~4.82 (m, 2H), 6.69 (s, 1H), 7.03~7.51 (m, 4H) [ $CDCl_3$ ]

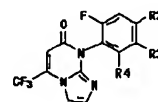
mp 192~194°C

前記実施例に準じて合成した本発明化合物の構造式と物性を前記実施例を含めそれぞれ第1表に示す。

【0071】〔第1表〕

【0072】

【化24】



【0073】

【表1】

化合物 No.	R2	R3	R4	
209	Cl	OCH <sub>2</sub> Me	H	mp 39-41°C
210	Cl	O-(tetrahydrofuran-3-yl)	H	mp 133-135°C
211	Cl	O-(2,3-epoxypropyl)	H	mp 126-128°C



【0074】

212	Cl	O-(3-Cl-5-CF <sub>3</sub> -2-pyridyl)	H	mp 61- 65°C
213	Cl	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> Ph	H	n <sub>D</sub> <sup>20</sup> . 7 1.4368
214	Cl	O-(tetrahydrofuran-2-yl)	H	mp 175-179°C
215	Cl	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	H	n <sub>D</sub> <sup>21.0</sup> 1.5263
216	Cl	OC(=O)-(4-MeO-phenyl)	H	mp 70- 73°C
217	Cl	OC(=O)-(4-F-phenyl)	H	mp 75- 78°C
218	Cl	OCH <sub>2</sub> -(tetrahydrofuran-2-yl)	H	mp 134-137°C
219	Cl	OCH <sub>2</sub> -(2,2-dimethyl-1,3-dioxolane-4-yl)	H	mp 45- 48°C
220	Cl	CO <sub>2</sub> C(Me) <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H	mp 129-131°C
221	Cl	OCH(CH <sub>2</sub> OEt) <sub>2</sub>	H	mp 86- 88°C
222	Cl	OCH <sub>2</sub> -(tetrahydropyran-2-yl)	H	mp 167-169°C
223	Cl	OCH(CO <sub>2</sub> Et) <sub>2</sub>	H	mp 30- 33°C
224	Cl	OCH <sub>2</sub> -(2-furyl)	H	mp 170-173°C
225	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH=CH <sub>2</sub>	H	mp 163-166°C
226	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe	H	mp 88- 90°C
227	Cl	O-(2-cyclohexen-1-yl)	H	mp 37- 40°C
228	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	H	mp 105-107°C
229	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H	mp 78- 80°C
230	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPh	H	mp 35- 38°C

【0075】

【表2】

化合物

No.	R2	R3	R4	
231	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-(2-Cl-phenyl)	H	mp 137-139°C
232	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	H	mp 98-100°C
233	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	H	mp 67- 70°C
234	Cl	OCH <sub>2</sub> CH(Me)OPh	H	mp 105-107°C
235	Cl	OCH(Me)CH <sub>2</sub> OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	n <sub>D</sub> <sup>24.9</sup> 1.4918
236	Cl	OCH <sub>2</sub> -(tetrahydrofuran-3-yl)	H	mp 123-125°C
237	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe	H	mp 60- 62°C
238	Cl	OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt	H	mp 98-100°C
239	Cl	O-(indan-2-yl)	H	mp 151-153°C
240	Cl	O-(indan-1-yl)	H	mp 69- 71°C
241	Cl	NHCOCH <sub>2</sub> OC(=O)Me	H	mp 195-198°C
242	Cl	N(COCH <sub>2</sub> OC(=O)Me)CH <sub>2</sub> C≡CH	H	mp 140-142°C
243		OC(=O)N(CH <sub>2</sub> C≡CH)	H	mp 80- 82°C
244		OC(F)HC(=O)N(CH <sub>2</sub> C≡CH)	H	mp 102-104°C
245		OCF <sub>2</sub> C(=O)N(CH <sub>2</sub> C≡CH)	H	mp 192-194°C
246	Cl	O-(tetrahydropyran-4-yl)	H	mp 180-182°C
247	Cl	OCH(CH <sub>2</sub> Cl)CH <sub>2</sub> OMe	H	mp 94- 96°C
248	Cl	OCH <sub>2</sub> -(2H,3H-benzo[e]1,4-dioxin-2-yl)	H	mp 63- 66°C
249	Cl	OCH <sub>2</sub> COMe	H	mp 202-205°C
250	Cl	OCH(Me)C≡N	H	mp 182-184°C
251		OCH <sub>2</sub> C(=O)NH	H	mp 198-201°C
252	Cl	OCH <sub>2</sub> -(2-pyridyl)	H	mp 147-150°C

【0076】

【表3】

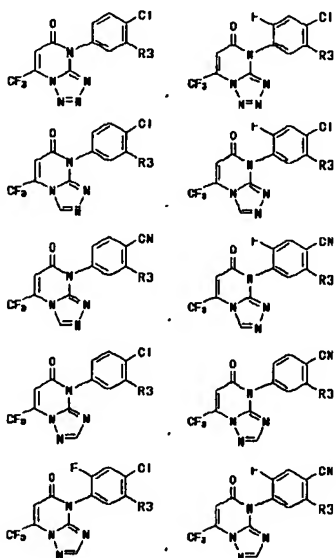
化合物			
No.	R2 R3	R4	
253	Cl OCH <sub>2</sub> -(3-methyloxetan-3-yl)	H	mp 156-158°C
254	Cl OCH(Ph)C≡N	H	mp 80- 88°C
255	Cl OCH <sub>2</sub> -(cyclohex-3-enyl)	H	mp 96- 99°C
256	Cl OCH(Me)COMe	H	mp 51- 53°C
257	Cl OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	H	mp 155-158°C
258	OCH(Me)C(=O)NH	H	mp 123-125°C
259	OCH(Me)C(=O)N(CH <sub>2</sub> C≡CH)	H	mp 199-202°C
260	OC(Me) <sub>2</sub> C(=O)NH	H	mp 134-136°C
261	OC(Me) <sub>2</sub> C(=O)N(CH <sub>2</sub> C≡CH)	H	mp 201-204°C
262	Cl O-(cyclohexan-1-one-2-yl)	H	mp 84- 89°C
263	Cl	OCH <sub>2</sub> CH=CH	mp 52- 55°C
264	OCH <sub>2</sub> C(=O)N(CH <sub>2</sub> C(=O)NH <sub>2</sub> )	H	mp >280°C (dec.)
265	OCH <sub>2</sub> C(=O)N(CH <sub>2</sub> -(2-pyridyl))	H	n <sub>D</sub> <sup>22.3</sup> 1.5524
266	OCH <sub>2</sub> C(=O)N(OCH <sub>2</sub> C≡CH)	H	mp 84- 86°C
267	OCH <sub>2</sub> C(=O)N(CH(CO <sub>2</sub> Et) <sub>2</sub> )	H	mp 58- 60°C
268	Cl	OC(Me)=CH	mp 185-188°C

前記スキームあるいは実施例に準じて合成される本発明化合物を前記実施例で合成した化合物も含め第2表および第3表に示すが、本発明はこれらによって限定されるものではない。

【0077】〔第2表〕

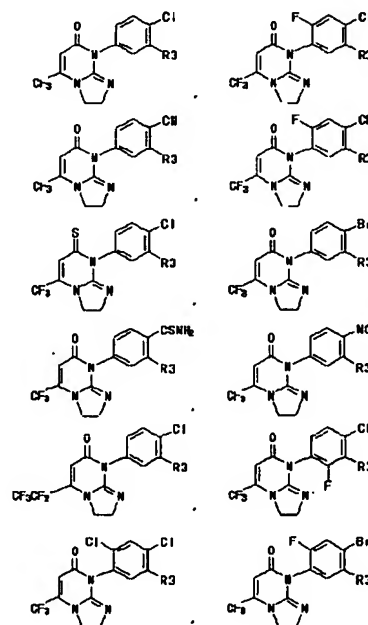
【0078】

【化25】



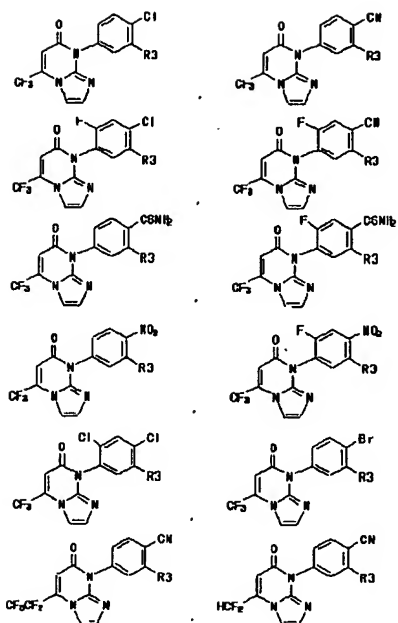
【0079】

【化26】



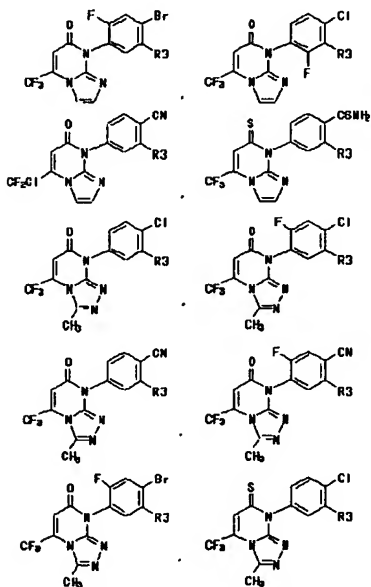
【0080】

【化27】



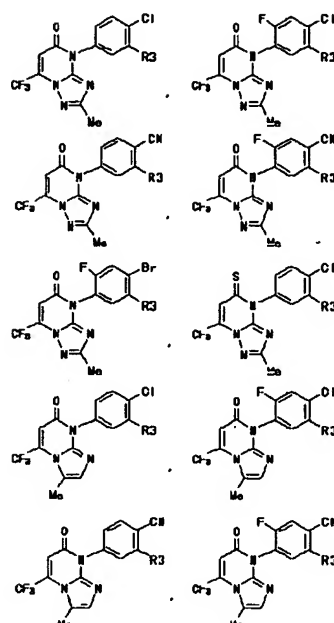
【0081】

【化28】



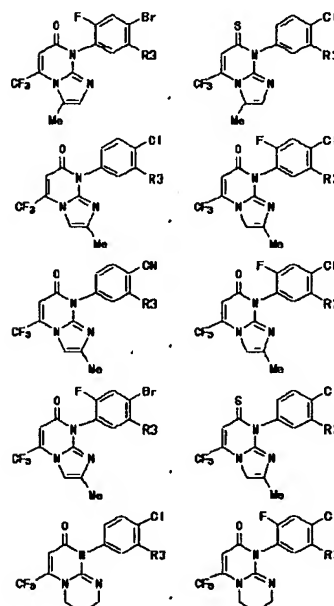
【0082】

【化29】



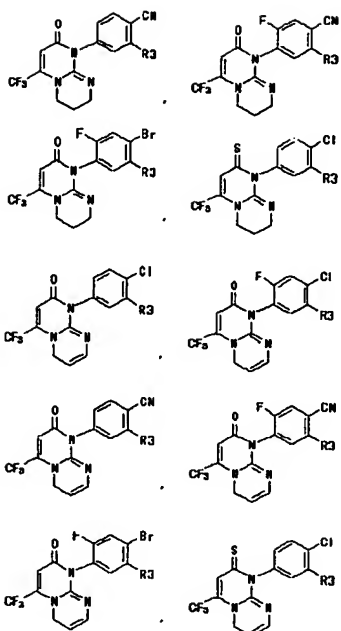
【0083】

【化30】

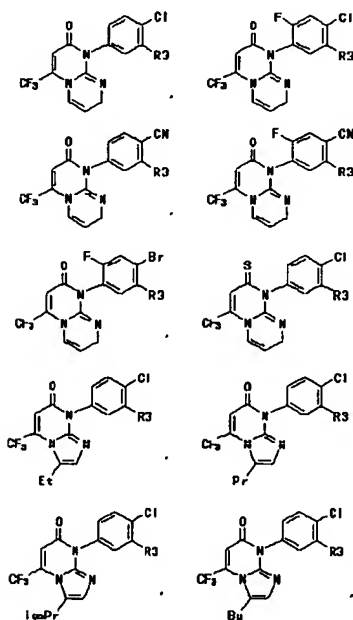


【0084】

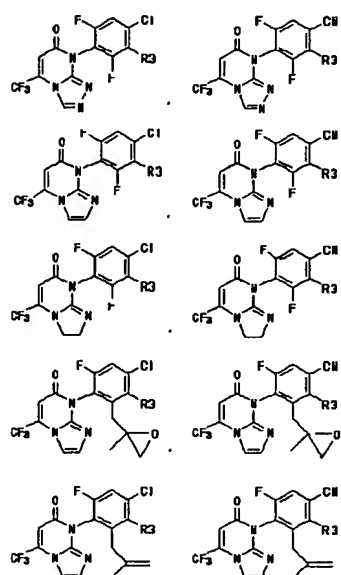
【化31】



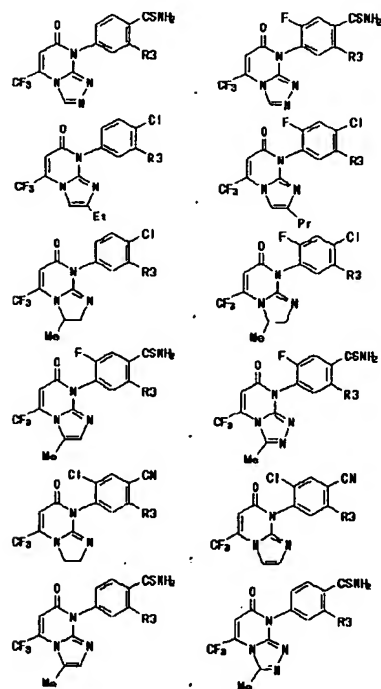
【0085】  
【化32】



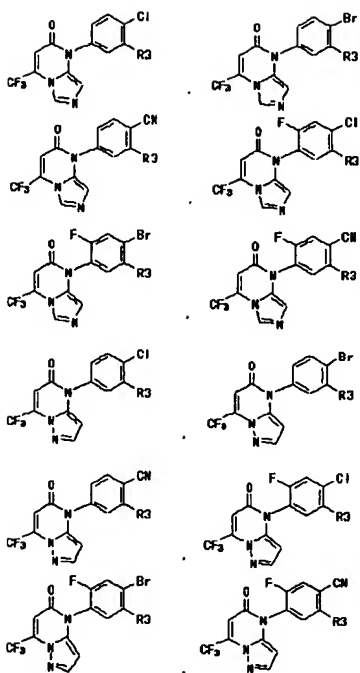
【0086】  
【化33】



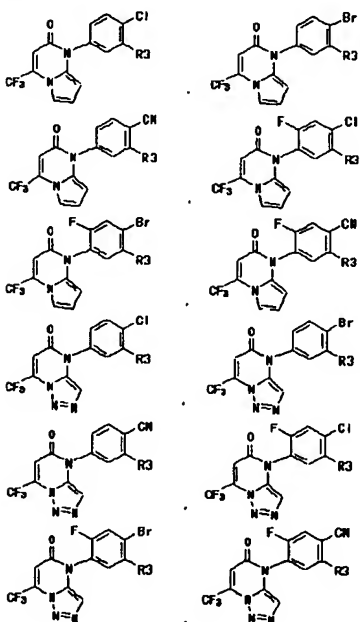
【0087】  
【化34】



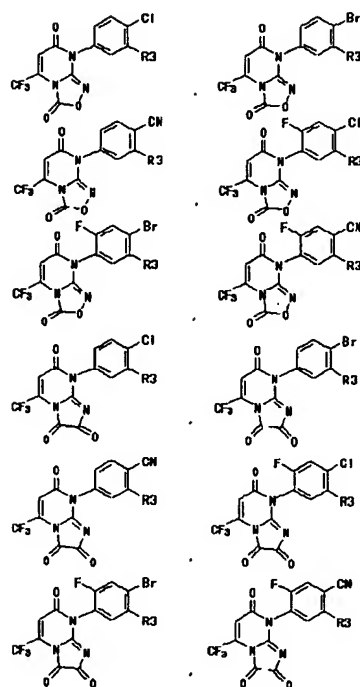
【0088】  
【化35】



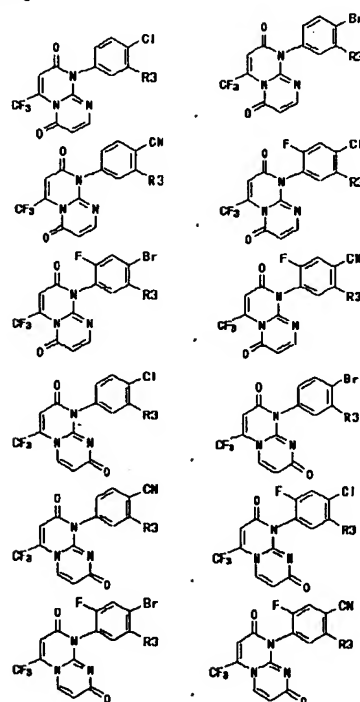
【0089】  
【化36】



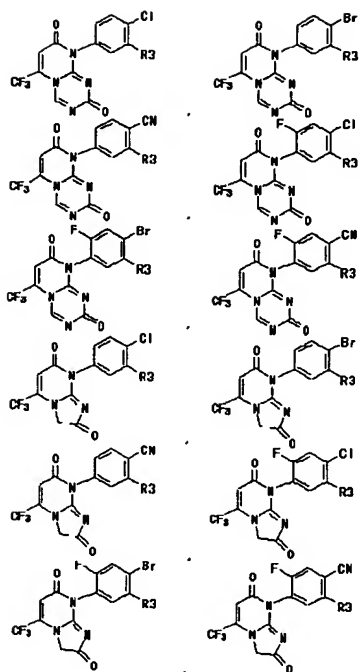
【0090】  
【化37】



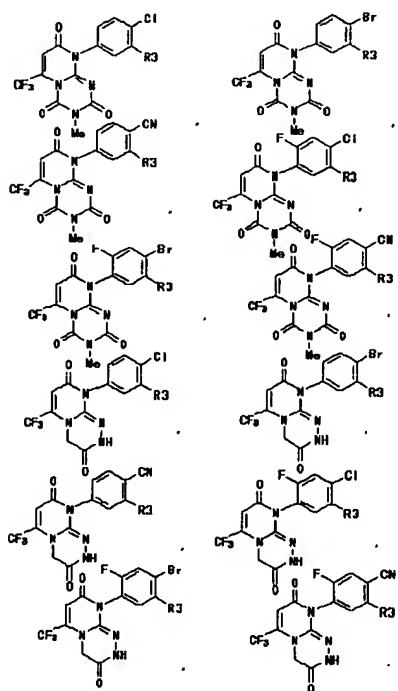
【0091】  
【化38】



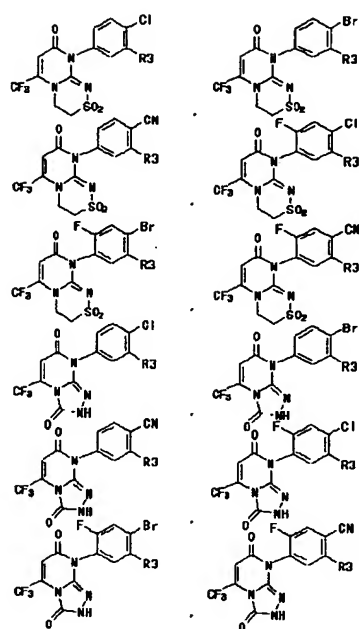
【0092】  
【化39】



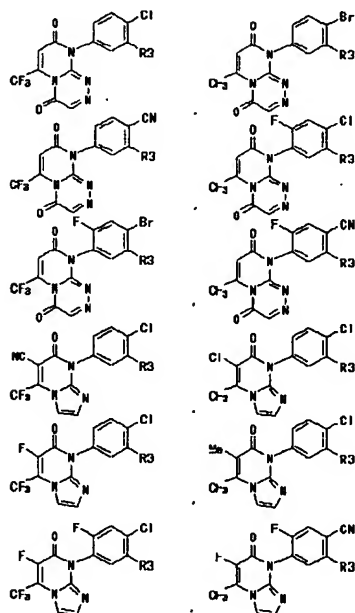
【0093】  
【化40】



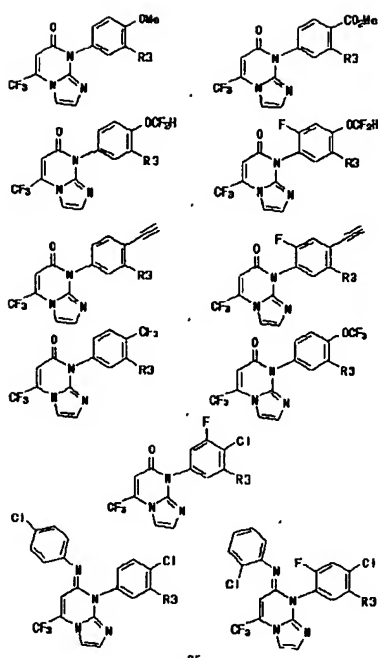
【0094】  
【化41】



【0095】  
【化42】



【0096】  
【化43】



【0097】

【表4】

R3

OCH<sub>2</sub>SMe, O-(tetrahydrofuran-3-yl), O-(2,3-epoxypropyl), O-(3-Cl-5-CF<sub>3</sub>-2-pyridyl), OCH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>Ph, O-(tetrahydrofuran-2-yl), OCH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe, OC(=O)(4-MeO-Phenyl), OC(=O)(4-F-Phenyl), OCH<sub>2</sub>-(tetrahydrofuran-2-yl), OCH<sub>2</sub>-(2,2-dimethyl-1,3-dioxolane-4-yl), OCH(CH<sub>2</sub>OEt)<sub>2</sub>, -OCH<sub>2</sub>-(tetrahydropyran-2-yl), OCH(CO<sub>2</sub>Et)<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>-(2-furyl), OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH=CH<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SMe, O-(2-cyclohexen-1-yl), OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OPh, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O-(2-Cl-phenyl), OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OMe, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl, OCH<sub>2</sub>CH(Me)OPh, OCH(Me)CH<sub>2</sub>OPh, OCH<sub>2</sub>-(tetrahydrofuran-3-yl), OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SMe, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OEt, O-(indan-2-yl), O-(indan-1-yl), O-(tetrahydropyran-4-yl), OCH(CH<sub>2</sub>Cl)CH<sub>2</sub>OMe, OCH<sub>2</sub>-(2H,3H-benzo[e]1,4-dioxin-2-yl), OCH<sub>2</sub>COMe, OCH<sub>2</sub>COEt, OCH<sub>2</sub>COPr, OCH<sub>2</sub>-(2-pyridyl), OCH<sub>2</sub>-(3-pyridyl), OCH<sub>2</sub>-(3-methyloxetan-3-yl), OCH(Ph)C≡N, OCH(Me)C≡N, OCH(Et)C≡N, OCH<sub>2</sub>-(cyclohex-3-enyl), OCH(Pr)C≡N, OCH(Me)COMe, OCH(Et)COMe,

【0098】

【表5】

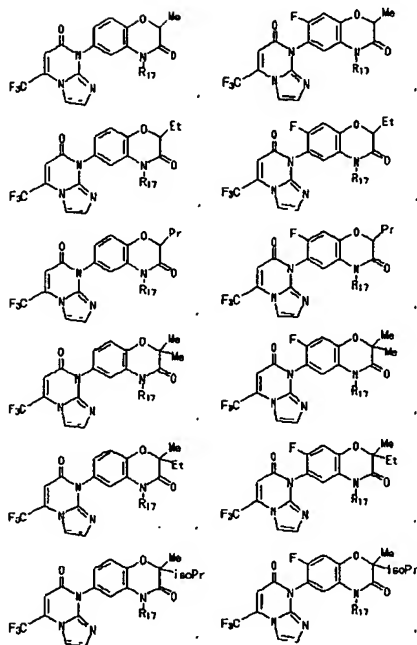
R3

OCH(Pr)COMe、OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>Me、OCH(Me)COEt、  
 OCH(Me)COPr、O-(cyclohexan-1-one-2-yl)  
 )、N(COCF<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>C≡CH、N(COPh)CH<sub>2</sub>C≡CH、NHCO  
 CH<sub>2</sub>OC(=O)Me、N(COCH<sub>2</sub>OC(=O)Me)CH<sub>2</sub>C≡CH、C  
 O<sub>2</sub>C(Me)<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH=CH<sub>2</sub>またはC(=O)NHCH(Me)Ph

〔第3表〕

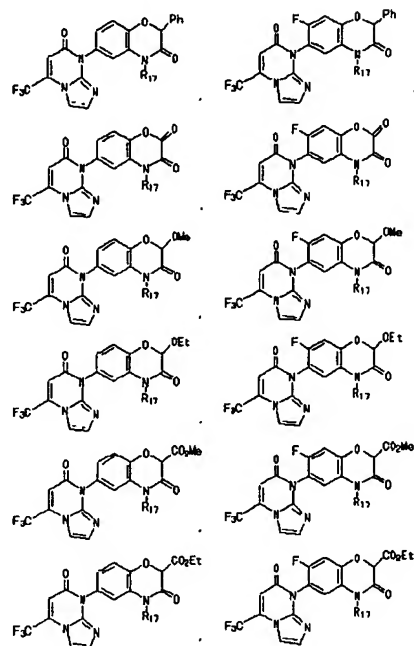
【0099】

【化44】



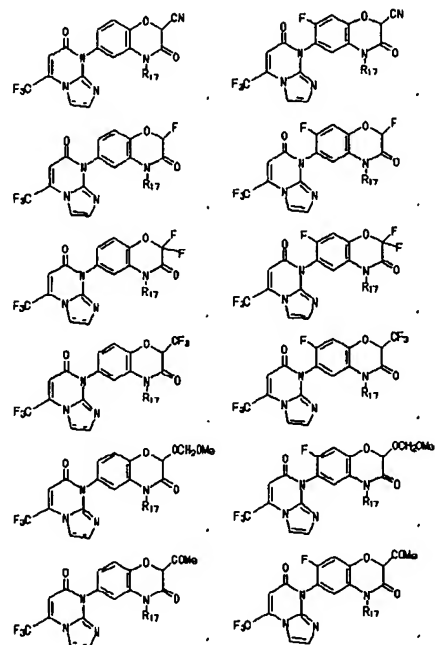
【0100】

【化45】



【0101】

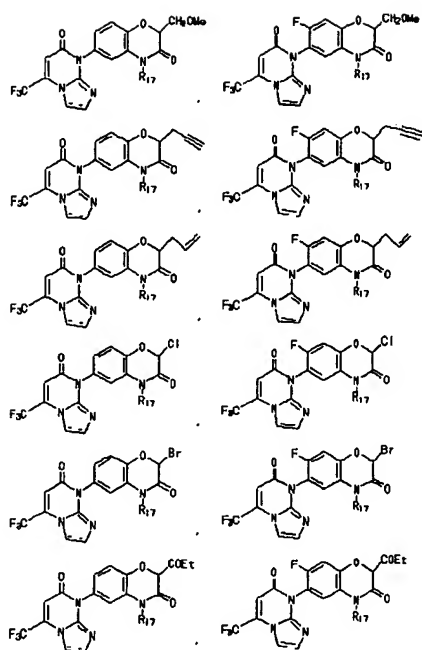
【化46】



【0102】

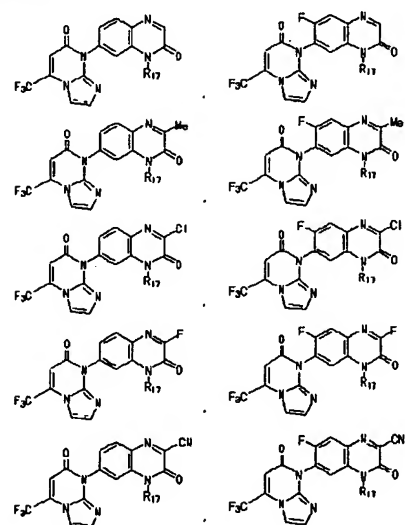


## 【化47】



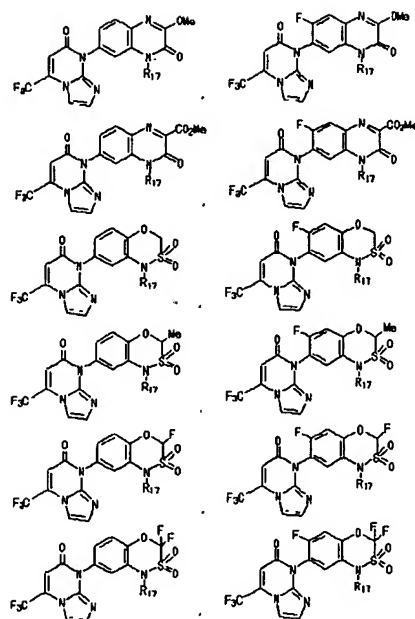
## 【0103】

## 【化48】



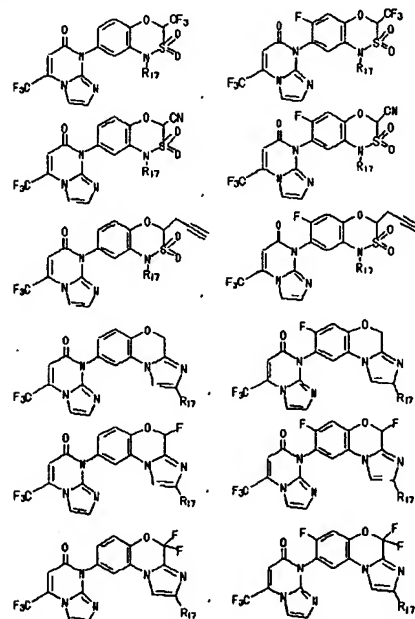
## 【0104】

## 【化49】



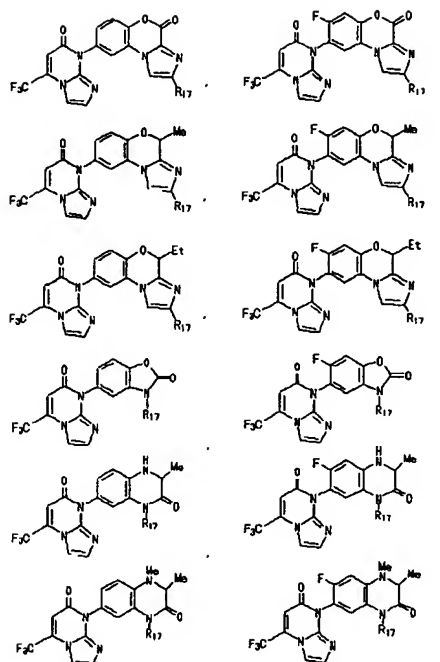
## 【0105】

## 【化50】



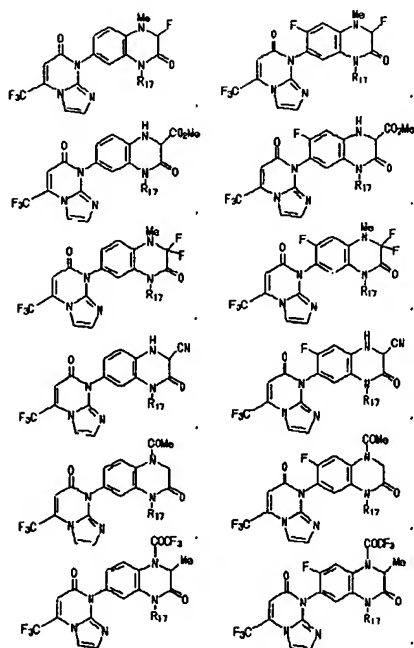
## 【0106】

## 【化51】



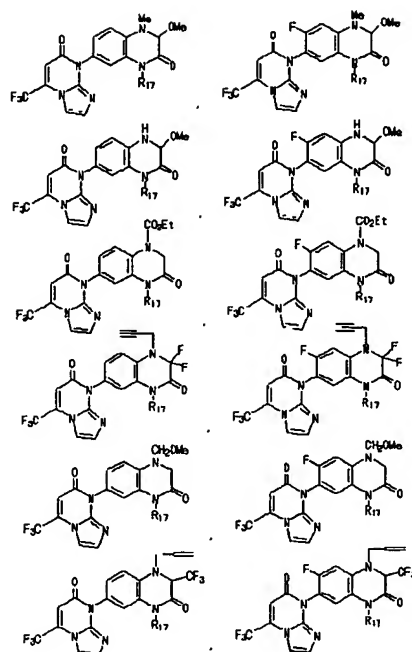
【0107】

【化52】



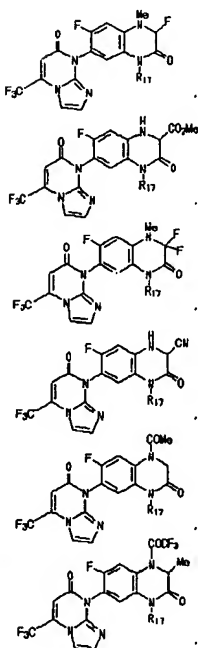
【0108】

【化53】



【0109】

【表6】



R17

Me, Et, Pr, iso-Pr, Bu, sec-Bu, iso-Bu, H, N  
 H<sub>2</sub>, OH, CH<sub>2</sub>CONH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>cyclo-Pr, CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>Me, CH<sub>2</sub>  
 CO<sub>2</sub>Et, COMe, COEt, COPr, CO-iso-Pr, COBu,  
 CO-tert-Bu, CO-cyclo-Pr, COCF<sub>3</sub>, CH(Me)C

$\text{O}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}(\text{Me})\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{Ph}$ 、 $\text{CH}_2-(2\text{-Cl-Phenyl})$ 、 $\text{CH}_2-(3\text{-Cl-Phenyl})$ 、 $\text{CH}_2-(4\text{-Cl-Phenyl})$ 、 $\text{CH}_2-(2\text{-pyridyl})$ 、 $\text{CH}_2-(3\text{-pyridyl})$ 、 $\text{CH}_2-(4\text{-pyridyl})$ 、 $\text{CH}(\text{CO}_2\text{Et})_2$ 、 $\text{CH}(\text{CO}_2\text{Me})_2$ 、 $\text{OPr}$ 、 $\text{O-iso-Pr}$ 、 $\text{OBu}$ 、 $\text{O-tert-Bu}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{OCH}(\text{Me})\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{OC}(\text{Me})_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{OCH}(\text{Me})\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{OC}(\text{Me})_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{OCH}(\text{CH}_2\text{F})_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{OEt}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OEt}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{N}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $\text{CH}_2\text{OMe}$ 、 $\text{OMe}$ 、 $\text{OEt}$ 、 $\text{CH}_2\text{OEt}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$ 、 $\text{CH}_2\text{CCl}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CBr}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}(\text{Me})\text{C}\equiv\text{CH}$ 、 $\text{CH}(\text{Me})\text{CH}=\text{CH}_2$ または $\text{CH}(\text{Me})\text{C}\equiv\text{N}$

尚、表中の記号は以下の意味を表す。

$\text{Me}$ :  $\text{CH}_3$   
 $\text{Et}$ :  $\text{CH}_2\text{CH}_3$   
 $\text{Pr}$ :  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$   
 $\text{iso-Pr}$ :  $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$   
 $\text{cyclo-Pr}$ :  $\text{CH}(\text{CH}_2)_2$   
 $\text{Bu}$ :  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$   
 $\text{sec-Bu}$ :  $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{C}_2\text{H}_5$   
 $\text{iso-Bu}$ :  $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$   
 $\text{tert-Bu}$ :  $\text{C}(\text{CH}_3)_3$   
 $\text{cyclo-Bu}$ :  $\text{CH}(\text{CH}_2)_3$   
 $\text{Pn}$ :  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$   
 $\text{cyclo-Pn}$ :  $\text{CH}(\text{CH}_2)_4$   
 $\text{iso-Pn}$ :  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$   
 $\text{neo-Pn}$ :  $\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$   
 $\text{cyclo-Hex}$ :  $\text{CH}(\text{CH}_2)_5$   
 $\text{tert-Pn}$ :  $\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{C}_2\text{H}_5$   
 $\text{Hex}$ :  $(\text{CH}_2)_5\text{CH}_3$   
 $\text{Hep}$ :  $(\text{CH}_2)_6\text{CH}_3$   
 $\text{Oct}$ :  $(\text{CH}_2)_7\text{CH}_3$   
 $\text{Ph}$ ,  $\text{Phenyl}$ :  $\text{C}_6\text{H}_5$   
 $4\text{-Cl-Ph}$ :  $4\text{-Cl-Phenyl}$

本発明化合物を使用するにあたっては、通常適当な固体担体又は液体担体と混合し、更に所望により界面活性剤、浸透剤、展着剤、増粘剤、凍結防止剤、結合剤、固結防止剤、崩壊剤、消泡剤、防腐剤および分解防止剤等を添加して、液剤、乳剤、水和剤、水溶剤、顆粒水和剤、顆粒水溶剤、懸濁剤、乳濁剤、サスボエマルジョン、マイクロエマルジョン、粉剤、粒剤およびゲル剤等任意の剤型の製剤にて実用に供することができる。また、省力化および安全性向上の観点から、上記任意の剤型の製剤を水溶性包装体に封入して供することもできる。なお必要に応じて、製剤または散布時に複数の他の除草剤、殺虫剤、殺菌剤、植物生長調整剤、肥料等と混合使用することも可能である。

【0110】固体担体としては、例えば石英、カオリナイト、パイロフィライト、セリサイト、タルク、ベントナイト、酸性白土、アタパルジャイト、ゼオライトおよび珪藻土等の天然鉱物質類、炭酸カルシウム、硫酸アンモニウム、硫酸ナトリウムおよび塩化カリウム等の無機塩類、合成珪酸ならびに合成珪酸塩が挙げられる。

【0111】液体担体としては、例えばエチレングリコール、プロピレングリコールおよびイソプロパノール等のアルコール類、キシレン、アルキルベンゼンおよびアルキルナフタレン等の芳香族炭化水素類、ブチルセロソルブ等のエーテル類、シクロヘキサノン等のケトン類、γ-ブチロラクトン等のエステル類、N-メチルピロリドンおよびN-オクチルピロリドン等の酸アミド類、大豆油、ナタネ油、綿実油およびヒマシ油等の植物油ならびに水が挙げられる。

【0112】これら固体および液体担体は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

【0113】界面活性剤としては、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレンブロックコポリマー、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステルおよびポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル等のノニオン性界面活性剤、アルキル硫酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、アルキルスルホコハク酸塩、ナフタレンスルホン酸塩、アルキルナフタレンスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、アルキルナフタレンスルホン酸のホルマリン縮合物の塩、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル硫酸および燐酸塩、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル硫酸および燐酸塩、ポリカルボン酸塩およびポリスチレンスルホン酸塩等のアニオン性界面活性剤、アルキルアミン塩およびアルキル4級アンモニウム塩等のカチオン性界面活性剤ならびにアミノ酸型およびベタイン型等

の両性界面活性剤が挙げられる。

【0114】これら界面活性剤の含有量は、特に限定されるものではないが、本発明の製剤100重量部に対し、通常0.05～20重量部の範囲が望ましい。また、これら界面活性剤は、単独で用いても2種以上を併用してもよい。

【0115】次に本発明化合物を用いる場合の製剤の配合例を示す。但し本発明の配合例は、これらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

#### 【0116】〔水和剤〕

本発明化合物	0.1～80部
固体担体	5～98.9部
界面活性剤	1～10部
その他	0～5部

その他として、例えば固結防止剤、分解防止剤等が挙げられる。

#### 【0117】〔乳剤〕

本発明化合物	0.1～30部
液体担体	45～95部
界面活性剤	4.9～15部
その他	0～10部

その他として、例えば展着剤、分解防止剤等が挙げられる。

#### 【0118】〔懸濁剤〕

本発明化合物	0.1～70部
液体担体	15～98.89部
界面活性剤	1～12部
その他	0.01～30部

その他として、例えば凍結防止剤、増粘剤等が挙げられる。

#### 【0119】〔顆粒水和剤〕

本発明化合物	0.1～90部
固体担体	0～98.9部
界面活性剤	1～20部
その他	0～10部

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

#### 【0120】〔液剤〕

本発明化合物	0.01～70部
液体担体	20～99.99部
その他	0～10部

その他として、例えば凍結防止剤、展着剤等が挙げられる。

#### 【0121】〔粒剤〕

本発明化合物	0.01～80部
固体担体	10～99.99部
その他	0～10部

その他として、例えば結合剤、分解防止剤等が挙げられる。

#### 【0122】〔粉剤〕

本発明化合物	0.01～30部
固体担体	65～99.99部
その他	0～5部

その他として、例えばドリフト防止剤、分解防止剤等が挙げられる。

【0123】使用に際しては上記製剤を水で1～10000倍に希釈してまたは希釈せずに、有効成分が1ヘクタール (ha) 当たり0.001～50kg、好ましくは0.01～10kgになるように散布する。

#### 【0124】製剤例

次に具体的に本発明化合物を有効成分とする農薬製剤例を示すがこれらのみに限定されるものではない。なお、以下の配合例において「部」は重量部を意味する。

#### 【0125】〔配合例1〕水和剤

本発明化合物No. 243	20部
パイロフィライト	74部
ソルボール5039	4部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業(株)商品名)  
カープレックス#80D 2部  
(合成含水珪酸：塩野義製薬(株)商品名)  
以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

#### 【0126】〔配合例2〕乳剤

本発明化合物No. 244	5部
キシレン	75部
N-メチルピロリドン	15部
ソルボール2680	5部

(非イオン性界面活性剤とアニオン性界面活性剤との混合物：東邦化学工業(株)商品名)  
以上を均一に混合して乳剤とする。

#### 【0127】〔配合例3〕懸濁剤(フロアブル剤)

本発明化合物No. 245	25部
アグリゾールS-710	10部

(非イオン性界面活性剤：花王(株)商品名)  
ルノックス1000C 0.5部  
(アニオン性界面活性剤：東邦化学工業(株)商品名)  
キサンタンガム 0.2部  
水 64.3部  
以上を均一に混合した後、湿式粉碎して懸濁剤とする。

#### 【0128】〔配合例4〕顆粒水和剤(ドライフロアブル剤)

本発明化合物No. 250	75部
ハイテノールNE-15	5部

(アニオン性界面活性剤：第一工業製薬(株)商品名)  
バニレックスN 10部  
(アニオン性界面活性剤：日本製紙(株)商品名)  
カープレックス#80D 10部  
(合成含水珪酸：塩野義製薬(株)商品名)  
以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混

合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して顆粒水和剤とする。

【0129】〔配合例5〕粒 剤

本発明化合物No. 259 5部

ベントナイト 50部

タルク 45部

以上を均一に混合粉碎した後、少量の水を加えて攪拌混合し、押出式造粒機で造粒し、乾燥して粒剤とする。

【0130】〔配合例6〕粉 剤

本発明化合物No. 268 3部

カープレックス#80D 0.5部

(合成含水珪酸：塩野義製薬(株)商品名)

カオリナイト 95部

リン酸ジイソプロピル 1.5部

以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。

【0131】使用に際しては上記水和剤、乳剤、フロアブル剤、粒状水和剤は水で50～1000倍に希釈して、有効成分が1ヘクタール(ha)当たり0.0001～10kgになるように散布する。

【0132】次に、本発明化合物の除草剤としての有用性を以下の試験例において具体的に説明する。

〔試験例-1〕湛水条件における雑草発生前処理による除草効果試験

内径3.2cm、深さ9cmの円筒形プラスチックカップ中に沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深4cmの湛水条件とする。上記のポットに2葉期のイネを移植し、更にノビエ、ホタルイ、コナギの種子を混播した。ポットを25～30℃の温室内において植物を育成し、播種後1日目に水面へ所定の薬量になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を処理した。処理後3週間目に各種雑草に対する除草効果及びイネに及ぼす影響について下記の判定基準に従い目視により調査した。0は影響なし、5は完全枯死を示す5段階評価である。結果を第4-1表に示す。

【0133】なお、各表中のNo. は実施例に記載した化合物No. に対応し、記号は次の意味を示す。

A: ノビエ、B: ホタルイ、C: コナギ、a: イネ

判定基準

5…殺草率90%以上(ほとんど完全枯死)

4…殺草率70%以上90%未満

3…殺草率40%以上70%未満

2…殺草率20%以上40%未満

1…殺草率5%以上20%未満

0…殺草率5%未満(ほとんど効果なし)

〔試験例-2〕湛水条件における雑草発生後処理による除草効果試験

内径3.2cm、深さ9cmの円筒形プラスチックカップ中に沖積土壌を入れた後、水を入れて混和し、水深4cmの湛水条件とする。上記のポットにノビエ、ホタルイ、コナギの種子を混播した。ポットを25～30℃の

温室内において植物を育成し、播種後14日目に水面へ所定の薬量になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を処理した。処理後3週間目に各種雑草に対する除草効果について試験例-1の判定基準に従い目視により調査した。結果を第4-2表に示す。なお、各表中のNo. は実施例に記載した化合物No. に対応し、記号は次の意味を示す。

A: ノビエ、B: ホタルイ、C: コナギ

〔試験例-3〕土壌処理による除草効果試験

縦33cm、横33cm、深さ8cmのプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、メヒシバ、エノコログサ、カラスミギ、ブラックグラス、イチビ、ブタクサ、アオゲイトウ、シロザ、イヌタデ、オオイヌノフグリ、ハコベ、トウモロコシ、ダイズ、ワタ、コムギ、ビートの種子を混播、約1.5cm覆土した後、所定の薬量になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を土壌表面へ均一に散布した。薬液散布後3週間目に各種雑草に対する除草効果及び作物に及ぼす影響について試験例-1の判定基準に従い目視により調査した。0は影響なし、5は完全枯死を示す5段階評価である。結果を第4-3表に示す。

【0134】なお、各表中のNo. は実施例に記載した化合物No. に対応し、記号は次の意味を示す。

D: メヒシバ、E: エノコログサ、F: カラスミギ、

G: ブラックグラス、H: イチビ、I: ブタクサ、J:

アオゲイトウ、K: シロザ、L: イヌタデ、M: オオイヌノフグリ、

N: ハコベ、b: トウモロコシ、c: ダイズ、

d: ワタ、e: コムギ、f: ビート

〔試験例-4〕茎葉処理による除草効果試験

縦33cm、横33cm、深さ8cmのプラスチック製箱に殺菌した洪積土壌を入れ、メヒシバ、エノコログサ、カラスミギ、ブラックグラス、イチビ、ブタクサ、アオゲイトウ、シロザ、イヌタデ、オオイヌノフグリ、ハコベ、トウモロコシ、ダイズ、ワタ、コムギ、ビートの種子を混播、約1.5cm覆土した後、25～30℃の温室において植物を14日間育成し、所定の薬量になるように、配合例に準じて調製した本発明化合物を茎葉部へ均一に散布した。薬液散布後3週間目に各種雑草に対する除草効果及び作物に及ぼす影響について試験例-1の判定基準に従い目視により調査した。0は影響なし、5は完全枯死を示す5段階評価である。結果を第4-4表に示す。

【0135】なお、各表中のNo. は実施例に記載した化合物No. に対応し、記号は次の意味を示す。

D: メヒシバ、E: エノコログサ、F: カラスミギ、

G: ブラックグラス、H: イチビ、I: ブタクサ、J:

アオゲイトウ、K: シロザ、L: イヌタデ、M: オオイヌノフグリ、

N: ハコベ、b: トウモロコシ、c: ダイズ、

d: ワタ、e: コムギ、f: ビート

〔第4-1表〕

【0136】

【表7】

化合物 No.	薬量 g/a	A	B	C	a
209	0.64	5	5	5	2
210	0.64	5	5	5	4
211	0.64	0	5	5	1
212	0.64	3	1	5	0
213	0.64	5	5	5	1
214	0.64	5	5	5	3
215	0.64	5	5	5	3
216	0.64	4	3	5	1
217	0.64	4	5	5	1
218	0.64	5	5	5	3
219	0.64	5	4	5	4
220	0.64	5	4	5	1
221	0.64	5	4	5	1
222	0.64	5	3	5	1
223	0.64	3	1	5	0
224	0.64	5	2	5	1
225	0.64	5	3	5	1
226	0.64	2	3	5	2
227	0.64	5	3	5	1
228	0.64	5	5	5	1
229	0.64	5	5	5	1
230	0.64	5	3	5	1

【0137】

【表8】

化合物 No.	薬量 g/a	A	B	C	a
231	0.64	5	2	5	0
232	0.64	5	4	5	3
233	0.64	5	5	5	1
234	0.64	5	4	5	1
235	0.64	5	5	5	2
236	0.64	5	5	5	3
237	0.64	3	2	5	1
238	0.64	5	5	5	4
239	0.64	5	1	5	0
240	0.64	5	1	5	0
241	0.64	2	3	5	0
242	0.64	0	3	5	1
243	0.64	5	5	5	3
244	0.64	5	5	5	5
245	0.64	5	5	5	5
246	0.64	5	5	5	1
247	0.64	5	5	5	2

248	0.64	5	4	5	1
249	0.64	5	5	5	3
250	0.64	5	5	5	4
251	0.64	5	5	5	1
252	0.64	5	5	5	1

【0138】

【表9】

化合物 No.	薬量 g/a	A	B	C	a
253	0.64	5	5	5	2
254	0.64	5	4	5	1
255	0.64	5	4	5	1
256	0.64	5	5	5	1
257	0.64	3	3	5	0
258	0.64	4	1	5	1
259	0.64	5	5	5	5
260	0.64	0	0	4	0
261	0.64	5	5	5	3
262	0.64	4	5	5	2
263	0.64	3	5	5	1
264	0.64	1	—	3	1
265	0.64	5	3	5	1
266	0.64	5	5	5	2
267	0.64	5	3	5	1

〔第4-2表〕

【表10】

【0139】

化合物 No.	薬量 g/a	A	B	C
209	0.64	4	4	4
210	0.64	5	5	5
211	0.64	2	5	5
213	0.64	3	3	5
214	0.64	4	3	3
215	0.64	5	0	5
216	0.64	4	0	4
217	0.64	5	2	5
218	0.64	5	5	5
219	0.64	5	4	5
220	0.64	1	1	2
221	0.64	4	3	4
222	0.64	4	1	4
223	0.64	1	0	2
224	0.64	4	3	4
225	0.64	4	3	5
226	0.64	0	1	4

227	0.64	5	2	4
228	0.64	5	1	5
229	0.64	5	2	5
230	0.64	5	2	4
231	0.64	1	0	3

【0140】

【表11】

化合物 No.	薬量 g/a	A	B	C
232	0.64	5	2	4
233	0.64	3	3	5
234	0.64	3	2	4
235	0.64	5	3	5
236	0.64	5	3	5
237	0.64	0	0	3
238	0.64	4	4	4
239	0.64	1	0	0
240	0.64	1	0	2
241	0.64	0	0	4
242	0.64	0	0	4
243	0.64	5	4	5
244	0.64	5	5	5
245	0.64	5	5	5
246	0.64	5	4	5
247	0.64	5	4	5
248	0.64	5	4	4
249	0.64	5	4	5
250	0.64	5	5	5
251	0.64	5	4	5
252	0.64	5	4	5
253	0.64	5	4	5

【0141】

【表12】

化合物 No.	薬量 g/a	A	B	C
254	0.64	4	4	4
255	0.64	5	4	4
256	0.64	5	5	5
257	0.64	1	1	—
258	0.64	2	1	4
259	0.64	5	4	5
260	0.64	0	—	3
261	0.64	5	4	5
262	0.64	4	4	4
263	0.64	4	—	4
264	0.64	1	—	1



(32) 100-247975 (P2000-247975A)

265	0.64	4	3	3
266	0.64	5	4	4
267	0.64	4	4	4

〔第4-3表〕  
〔0142〕

【表13】

化合物No.	薬量g/a	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	b	c	d	e	f
209	1.6	5	5	5	4	5	5	5	5	-	5	5	3	1	0	4	5
210	1.6	5	5	4	4	5	5	5	5	-	5	5	4	1	0	4	5
211	1.6	5	1	1	0	5	4	5	5	5	1	1	0	0	0	0	5
212	1.6	0	0	0	0	0	0	0	3	0	0	0	0	0	0	0	1
213	1.6	1	2	1	0	2	0	3	4	5	5	5	1	0	0	0	5
214	1.6	4	4	4	3	5	3	1	5	3	5	3	4	4	3	4	5
215	1.6	5	5	4	4	5	4	5	5	5	5	5	4	3	5	3	5
216	1.6	3	3	1	0	5	1	1	5	0	3	0	0	1	0	0	0
217	1.6	4	4	1	2	5	2	0	5	1	2	1	4	3	3	1	4
218	1.6	5	5	2	3	5	5	5	5	5	5	5	4	4	3	1	5
219	1.6	5	5	2	3	5	5	5	5	5	5	5	4	3	3	2	5
220	1.6	3	3	0	1	3	4	5	4	4	-	0	2	0	0	1	1
221	1.6	5	4	1	1	5	0	4	5	5	5	1	5	4	3	1	5
222	1.6	5	5	1	2	5	5	5	5	5	5	4	5	4	4	2	5
223	1.6	0	0	0	0	0	0	0	-	0	4	1	0	0	0	1	2
224	1.6	4	3	0	0	3	0	4	4	5	0	0	0	0	0	0	2
225	1.6	5	4	0	0	4	4	5	5	5	5	5	0	1	2	0	5
226	1.6	2	0	0	0	3	2	5	5	5	0	0	1	0	0	0	5
227	1.6	5	4	-	4	5	1	5	-	5	5	5	1	0	0	1	5
228	1.6	5	5	-	4	5	5	5	-	5	5	5	4	1	0	2	5
229	1.6	5	5	-	5	5	5	5	-	5	5	5	4	1	0	3	5
230	1.6	5	4	5	5	3	2	5	-	5	5	5	0	0	0	5	5
231	1.6	2	1	0	-	3	5	4	-	5	5	5	0	0	0	0	4

【0143】

【表14】

化合物No.	薬量g/a	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	b	c	d	e	f
232	1.6	5	5	2	4	5	5	5	-	5	5	5	5	3	4	1	5
233	1.6	5	4	0	0	5	3	5	5	5	5	3	2	0	1	2	5
234	1.6	0	1	1	-	2	0	4	1	4	4	4	0	0	0	0	5
235	1.6	5	4	1	2	5	2	5	5	5	5	4	0	1	1	1	5
236	1.6	5	5	3	4	5	5	5	5	5	5	5	5	3	3	4	5
237	1.6	4	4	0	0	5	5	5	5	5	5	1	4	2	2	1	5
238	1.6	5	4	4	2	5	5	5	5	5	5	5	4	2	3	4	5
239	1.6	4	4	2	3	2	1	4	5	0	4	5	0	0	0	1	5
240	1.6	4	3	2	3	5	1	5	5	5	5	4	0	0	0	1	5
241	1.6	4	0	0	0	3	1	2	5	0	0	0	0	0	0	0	0
242	1.6	3	1	0	0	3	1	4	5	5	1	0	0	1	1	0	3
243	1.6	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	4	4	5
244	1.6	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	5	4	1	5	4	5

245	1.6	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	1	5	4	5
246	1.6	5	3	2	3	5	3	5	5	5	5	4	1	1	2	4	5
247	1.6	5	4	2	3	5	4	5	5	4	5	5	4	0	0	3	5
248	1.6	4	4	0	0	3	1	4	5	5	5	4	0	0	0	0	4
249	1.6	5	4	2	2	4	2	4	5	5	2	5	0	0	0	3	4
250	1.6	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	5	4	2	4	4	5
251	1.6	5	5	1	5	5	4	5	5	5	5	5	4	1	1	3	5
252	1.6	5	4	1	2	5	3	5	5	3	5	5	0	0	0	3	5
253	1.6	5	5	3	3	5	4	5	5	5	5	5	3	1	1	3	5
254	1.6	5	4	1	1	5	3	5	5	4	5	4	0	0	0	1	5

【0144】

【表15】

化合物No.	薬量g/a	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	b	c	d	e	f
255	1.6	4	3	0	0	3	2	5	4	5	-	2	0	0	0	0	0
256	1.6	5	5	3	1	5	5	5	5	5	-	4	4	3	2	2	5
257	1.6	0	0	0	0	3	2	5	5	5	-	0	0	0	0	0	5
258	1.6	3	3	0	0	1	3	5	5	4	2	0	0	1	0	0	4
259	1.6	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	4	5
260	1.6	0	0	0	0	1	3	5	5	5	0	0	0	0	0	0	4
261	1.6	5	5	3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	4	3	5
262	1.6	5	5	2	1	5	5	5	5	5	5	3	4	1	1	2	5
263	1.6	5	4	1	1	5	5	5	5	5	5	3	4	2	1	1	5
264	1.6	1	0	0	0	1	1	3	-	-	5	0	0	0	0	0	5
265	1.6	5	5	3	4	5	4	4	-	3	5	5	1	3	1	3	5
266	1.6	5	5	3	3	5	4	5	5	-	5	5	3	0	1	1	5
267	1.6	5	5	1	3	5	4	5	5	4	5	5	4	1	3	1	5

〔第4-4表〕

【表16】

【0145】

化合物No.	薬量g/a	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	b	c	d	e	f
209	1.6	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4	5
210	1.6	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4	5
211	1.6	5	4	2	2	5	5	5	5	5	-	5	3	4	4	2	5
212	1.6	2	1	1	1	4	3	5	4	5	4	3	2	2	5	1	4
213	1.6	5	5	2	3	5	5	5	5	5	5	5	3	4	5	2	5
214	1.6	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4	5
215	1.6	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	4	5
216	1.6	4	4	2	2	5	5	4	5	5	5	5	3	5	5	2	5
217	1.6	4	4	3	2	5	4	4	5	4	5	5	4	4	5	4	5
218	1.6	5	5	2	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	2	5
219	1.6	5	5	3	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
220	1.6	4	4	1	1	5	4	5	5	5	5	5	2	3	5	2	5
221	1.6	5	4	1	2	5	4	4	5	5	5	5	5	4	5	1	3
222	1.6	5	5	1	3	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	1	5
223	1.6	0	0	1	0	3	4	5	5	5	1	3	0	2	3	1	1
224	1.6	3	2	1	2	5	4	5	5	5	5	5	1	2	5	1	5

(34) 100-247975 (P2000-247975A)

225	1.6	2	1	1	1	5	5	5	5	5	5	5	0	3	5	1	1
226	1.6	3	4	1	1	5	5	5	5	5	5	5	2	5	5	-	5
227	1.6	5	5	3	2	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	1	5
228	1.6	4	5	-	4	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	2	5
229	1.6	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	5	5
230	1.6	4	5	5	3	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	2	5
231	1.6	0	2	1	0	5	4	5	-	5	5	5	1	5	5	1	5

【0146】

【表17】

化合物No.	薬量g/a	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	b	c	d	e	f
232	1.6	5	5	4	5	5	5	5	-	5	5	5	5	5	5	3	5
233	1.6	4	4	2	3	5	5	5	5	5	5	5	1	4	5	1	5
234	1.6	2	3	0	2	5	-	5	5	5	5	5	1	4	5	0	5
235	1.6	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	2	5	5	4	5
236	1.6	5	5	4	3	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4	5
237	1.6	5	5	3	1	5	5	5	5	5	5	4	2	4	5	1	5
238	1.6	5	5	3	2	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5
239	1.6	5	4	2	4	5	5	5	5	5	5	5	2	3	5	2	5
240	1.6	5	5	0	4	4	5	5	5	5	5	5	2	4	5	1	5
241	1.6	4	2	0	0	5	3	5	5	4	5	3	1	2	5	0	5
242	1.6	3	1	0	0	5	3	5	4	5	3	3	1	4	5	0	5
243	1.6	5	4	5	4	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	5	5
244	1.6	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4	5
245	1.6	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5
246	1.6	5	4	4	3	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	4	5
247	1.6	5	4	4	3	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	2	5
248	1.6	5	4	1	2	5	5	5	5	5	5	5	3	4	5	2	5
249	1.6	5	5	4	2	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	3	5
250	1.6	5	4	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5
251	1.6	5	5	1	5	5	4	5	5	5	5	5	4	5	5	2	5
252	1.6	5	4	5	5	5	5	5	5	-	5	5	3	4	5	2	5
253	1.6	5	5	5	4	5	5	5	5	5	5	5	3	5	5	3	5
254	1.6	5	4	2	3	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	1	5

【0147】

【表18】

化合物No.	薬量g/a	D	E	F	G	H	I	J	K	L	M	N	b	c	d	e	f	
255	1.6	5	4	1	0	5	5	5	5	1	5	5	3	4	5	1	5	
256	1.6	5	5	2	3	5	5	5	5	5	5	5	4	4	5	1	5	
257	1.6	4	1	1	2	5	5	5	5	5	5	5	2	4	5	0	5	
258	1.6	5	4	1	2	5	4	5	5	5	5	5	3	4	5	0	5	
259	1.6	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	
260	1.6	2	1	0	0	5	3	5	5	5	5	5	2	3	3	5	0	5
261	1.6	5	5	4	4	5	5	5	5	5	5	5	5	4	5	3	5	
262	1.6	5	5	3	2	5	4	5	5	5	5	5	4	4	5	2	5	
263	1.6	5	5	2	1	5	5	5	5	5	5	4	4	4	5	1	5	
264	1.6	5	3	1	1	5	5	5	-	3	5	4	3	3	5	1	5	

265	1.6	5	5	5	4	5	4	5	-	4	5	5	5	5	3	5
266	1.6	-	5	5	4	5	5	5	-	5	5	5	4	5	5	3
267	1.6	5	4	4	5	5	5	5	5	5	4	5	5	4	5	2

## フロントページの続き

(51) Int. Cl. <sup>7</sup>	識別記号	F I	(参考)
C 07 D 487/04	1 4 8	C 07 D 487/04	1 4 8
A 01 N 43/90	1 0 4	A 01 N 43/90	1 0 4
	1 0 5		1 0 5
	1 0 6		1 0 6
C 07 D 498/04	1 0 5	C 07 D 498/04	1 0 5
513/04	3 8 1	513/04	3 8 1
519/00	3 0 1	519/00	3 0 1
(72) 発明者 前田 兼成	千葉県船橋市坪井町722番地1日産化学工業株式会社中央研究所内	(72) 発明者 浜田 暢之	埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470日産化学工業株式会社生物科学研究所内
(72) 発明者 渡邊 重臣	埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470日産化学工業株式会社生物科学研究所内	F ターム(参考)	4C050 AA01 BB03 BB04 BB05 BB06 BB07 BB08 CC08 EE02 EE03 EE04 EE05 FF02 FF03 FF05 GG02 GG03 GG04 GG05 HH01 HH02 4C072 AA01 BB02 CC03 CC11 CC16 EE02 EE15 FF09 GG07 HH02 MM06 UU02 4H011 AB01 AB02 BA05 BB09 BC06 BC07 DA02 DA13 DA15 DA16 DD04
(72) 発明者 中平 国光	埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470日産化学工業株式会社生物科学研究所内		
(72) 発明者 大木 亨	埼玉県南埼玉郡白岡町大字白岡1470日産化学工業株式会社生物科学研究所内		